

- US 2004/0157863

(1)

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
7. November 2002 (07.11.2002)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 02/088127 A2

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: C07D 487/04, A01N 43/90 (74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER AKTIENGESELLSCHAFT; 51368 Leverkusen (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP02/04441 (81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(22) Internationales Anmeldedatum: 23. April 2002 (23.04.2002)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität: 101 21 102.3 27. April 2001 (27.04.2001) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): BAYER AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; 51368 Leverkusen (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): GEBAUER, Olaf [DE/DE]; Jesuitengasse 111, 50737 Köln (DE). GREUL, Jörg, Nico [DE/DE]; Am Sandberg 30 a, 42799 Leichlingen (DE). HEINEMANN, Ulrich [DE/DE]; Am Sonnenhang 1, 42799 Leichlingen (DE). ELBE, Hans-Ludwig [DE/DE]; Dasnöckel 59, 42329 Wuppertal (DE). KRÜGER, Bernd-Wieland [DE/DE]; Am Vorend 52, 51467 Bergisch Gladbach (DE). DUNKEL, Ralf [DE/DE]; Krischerstr. 22, 40789 Monheim (DE). VOERSTE, Arnd [DE/DE]; Salierring 33, 50677 Köln (DE). EBBERT, Ronald [DE/DE]; Hitdorfer Str. 305, 51371 Leverkusen (DE). WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike [DE/DE]; Oberer Markenweg 85, 56566 Neuwied (DE). KUCK, Karl-Heinz [DE/DE]; Pastor-Löh-Str. 30a, 40764 Langenfeld (DE). KITAGAWA, Yoshinori [JP/JP]; 1085, Aramachi, Moka-shi, Tochigi 321-4305 (JP).

(84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Erklärung gemäß Regel 4.17:

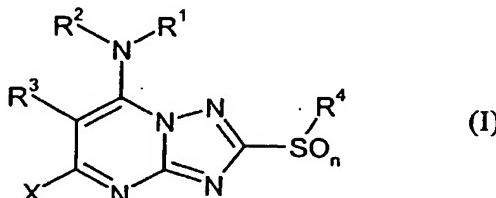
— hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii) für die folgenden Bestimmungsstaaten AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW. ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: TRIAZOLOPYRIMIDINES

(54) Bezeichnung: TRIAZOLOPYRIMIDINE

WO 02/088127 A2



(57) Abstract: The invention relates to novel triazoloypyrimidines of formula (I), wherein R¹, R², R³, R⁴, X and n have the meaning cited in the description. The invention also relates to several methods for the production of said novel substances and to their use in controlling undesirable microorganisms. The invention further relates to intermediate products having the formula cited in the description and to methods for the production of said intermediate products.

(57) Zusammenfassung: Neue Triazoloypyrimidine der Formel (I), in welcher R¹, R², R³, R⁴, X und n die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen haben, mehrere Verfahren zur Herstellung dieser neuen Stoffe und deren Verwendung zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen. Neue Zwischenprodukte der in der Beschreibung angegebenen Formeln sowie Verfahren zur Herstellung dieser Zwischenprodukte.

WO 02/088127 A2



Veröffentlicht:

- ohne internationalen Recherchenbericht und erneut zu veröffentlichen nach Erhalt des Berichts

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("*Guidance Notes on Codes and Abbreviations*") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

- 1 -

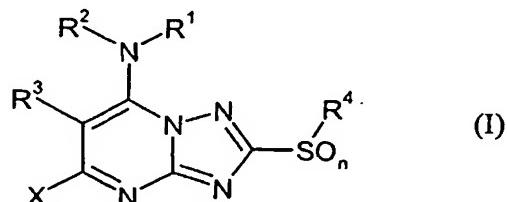
Triazolopyrimidine

Die vorliegende Erfindung betrifft neue Triazolopyrimidine, mehrere Verfahren zu deren Herstellung und deren Verwendung zur Bekämpfung von unerwünschten 5 Mikroorganismen. Die Erfindung betrifft außerdem neue Zwischenprodukte sowie Verfahren zu deren Herstellung.

Es ist bereits bekannt geworden, dass bestimmte Triazolopyrimidine fungizide Eigenschaften besitzen (vgl. EP-A 0 550 113, WO 94-20 501, EP-A 0 613 900, 10 US-A 5 612 345, EP-A 0 834 513, WO 98-46 607 und WO 98-46 608). Die Wirksamkeit dieser Stoffe ist gut, lässt aber bei niedrigen Aufwandmengen in manchen Fällen zu wünschen übrig.

Es wurden nun neue Triazolopyrimidine der Formel

15



in welcher

R¹ für Amino, für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls 20 substituiertes Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Alkinyl, gegebenenfalls substituiertes Cyloalkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkoxy, gegebenenfalls substituiertes Alkenyloxy, gegebenenfalls substituiertes Alkinyloxy, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyloxy, gegebenenfalls substituiertes Alkylamino, gegebenenfalls substituiertes Dialkylamino, gegebenenfalls substituiertes Alkenylamino, gegebenenfalls substituiertes Alkinylamino, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkylamino, gegebenenfalls substituiertes N-Cycloalkyl-N-alkyl-amino, gegebenenfalls substituiertes Alkyldenamino,

- 2 -

gegebenenfalls substituiertes Heterocycl oder für einen Rest der Formel -S-R⁵ steht, worin

- 5 R⁵ für gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes
Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Alkinyl oder gegebenenfalls
substituiertes Cycloalkyl steht,
- 10 R² für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substitu-
iertes Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Alkinyl oder gegebenenfalls sub-
stituiertes Cycloalkyl steht,
- oder
- 15 R¹ und R² gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen
gegebenenfalls substituierten heterocyclischen Ring stehen,
- 20 R³ für gegebenenfalls substituiertes Aryl steht,
- 20 R⁴ für gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkenyl
oder gegebenenfalls substituiertes Alkinyl steht,
- 25 X für Halogen steht und
- 25 n für 0, 1 oder 2 steht,
sowie Säureadditions-Salze von denjenigen Verbindungen der Formel (I),
in denen
- 30 R¹ für Amino steht,

- 3 -

gefunden.

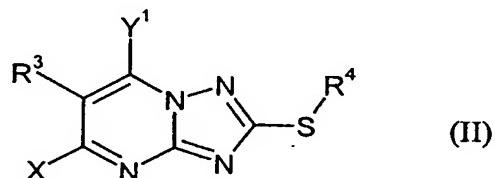
Die erfindungsgemäßen Verbindungen können je nach Substitutionsmuster gegebenenfalls als Mischungen verschiedener möglicher isomerer Formen, insbesondere von Stereoisomeren, wie z.B. E- und Z-, threo- und erythro-, sowie optischen Isomeren, gegebenenfalls aber auch von Tautomeren vorliegen. Ist R³ an 5 beiden Atomen, die der Bindungsstelle benachbart sind, ungleich substituiert, können die betreffenden Verbindungen in einer besonderen Form der Stereoisomerie, als Atropisomere, vorliegen.

10

Weiterhin wurde gefunden, dass sich Triazolopyrimidine der Formel (I) herstellen lassen, indem man

a) Dihalogen-triazolopyrimidine der Formel

15



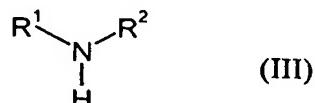
in welcher

R³, R⁴ und X die oben angegebenen Bedeutungen haben und

20

Y¹ für Halogen steht,

mit Aminen der Formel



25

in welcher

- 4 -

R¹ und R² die oben angegebenen Bedeutungen haben,

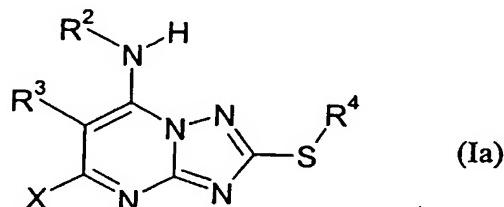
gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in
Gegenwart eines Säureakzepts umsetzt,

5

oder

b) Triazolopyrimidine der Formel

10

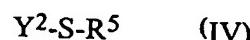


in welcher

R², R³, R⁴ und X die oben angegebenen Bedeutungen haben,

15

mit Sulfensäurehalogeniden der Formel



in welcher

20

R⁵ die oben angegebenen Bedeutungen hat und

Y² für Halogen steht,

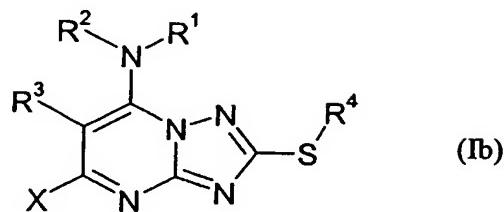
25

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in
Gegenwart eines Säureakzepts umsetzt,

oder

- 5 -

c) Triazolopyrimidine der Formel



in welcher

5

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und X die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Sauerstoff abgebenden Oxidationsmitteln gegebenenfalls in Gegenwart
eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Kataly-
10 sators umsetzt,

und gegebenenfalls an die so erhaltenen Verbindungen der Formel (I),

in denen

15

R^1 für Amino steht,

eine Säure addiert.

20 Schließlich wurde gefunden, dass sich die neuen Triazolopyrimidine der Formel (I) bzw. deren Säureadditions-Salze sehr gut zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen eignen. Sie zeigen vor allem eine starke fungizide Wirksamkeit und lassen sich sowohl im Pflanzenschutz als auch im Materialschutz verwenden.

25 Überraschenderweise besitzen die erfindungsgemäßen Triazolopyrimidine der Formel (I) eine wesentlich bessere mikrobizide Wirksamkeit als die konstitutionell ähnlichen, vorbekannten Stoffe gleicher Wirkungsrichtung.

- 6 -

Die erfindungsgemäßen Triazolopyrimidine sind durch die Formel (I) allgemein definiert.

R¹ steht bevorzugt für Amino;

5

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl, Heterocycl, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Oxo, Hydroxoimino und/oder Alkoximino mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen,

10

für gegebenenfalls durch Hydroxy, Alkenyloxy mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkoxycarbonyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen,

15

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocycl substituiertes Alkenyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocycl substituiertes Alkinyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,

20

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocycl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen,

25

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocycl substituiertes Alkoxy mit 1 bis 7 Kohlenstoffatomen,

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocycl substituiertes Alkenyloxy mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,

30

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocycl substituiertes Alkinyloxy mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,

- für gegebenenfalls durch Halogen, Cyloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocycl subsituiertes Cycloalkyloxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen,
- 5 für gegebenenfalls durch Halogen, Cyloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocycl subsituiertes Alkylamino mit 1 bis 7 Kohlenstoffatomen,
- 10 für gegebenenfalls durch Halogen, Cyloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocycl subsituiertes Dialkylamino mit 1 bis 7 Kohlenstoffatomen in jedem der Alkylreste,
- für gegebenenfalls durch Halogen, Cyloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocycl subsituiertes Alkenylamino mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,
- 15 für gegebenenfalls durch Halogen, Cyloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocycl subsituiertes Alkinylamino mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,
- für gegebenenfalls durch Halogen, Cyloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocycl subsituiertes Cycloalkylamino mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen,
- 20 für gegebenenfalls durch Halogen, Cyloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocycl subsituiertes N-Cycloalkyl-N-alkyl-amino mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen im Cycloalkylteil und 1 bis 7 Kohlenstoffatomen in Alkylteil,
- 25 für gegebenenfalls durch Halogen, Cyloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocycl subsituiertes Alkylidenamino mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,
- für gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocycl subsituiertes Heterocycl mit 5 oder 6 Ringgliedern oder
- 30 für -S-R⁵, worin

R⁵ für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocycll substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen,

5

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocycll substituiertes Alkenyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,

10

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocycll substituiertes Alkinyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen oder

15

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocycll substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen steht,

20

wobei die zuvor genannten Heterocycll-Reste einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkoxy mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Halogenalkylthio mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen und/oder Phenyl,

25

und wobei die zuvor genannten Phenyl-Reste einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch

30

Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl;

- 9 -

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;
jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl oder Alkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen;

5

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

10

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkenyl oder Halogenalkenyl-oxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

15

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxy carbonyl, Alkylsulfonyloxy, Hydroximinoalkyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen;

20

Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen,

25

oder einfach substituiert sein können durch zweifach in ortho-Stellung verknüpftes Alkylen mit 3 oder 4 Kohlenstoffatomen oder Dioxyalkylen mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen, wobei diese Reste einfach bis vierfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffaromen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen.

R² steht bevorzugt für Wasserstoff,

30

- 10 -

- für gegebenenfalls durch Halogen, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Oxo, Hydroximino, Alkoximino mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen substituiertes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen,
5
- für gegebenenfalls durch Halogen und/oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen substituiertes Alkenyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen oder
10 für gegebenenfalls durch Halogen und/oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen substituiertes Alkinyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen oder
für gegebenenfalls durch Halogen und/oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,
15 R¹ und R² stehen bevorzugt gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen 3- bis 6-gliedrigen heterocyclischen Ring, der einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch
Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen,
20 Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen,
Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, Oxo;
25 Alkylcarbonyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen,
Alkoxycarbonyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen,
Aminoalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen,

Alkylcarbonylamino mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder

an dem ein Phenylring anelliert ist.

5 R³ steht bevorzugt für Phenyl, das einfach bis fünffach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch

Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl;

10 jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;

15 jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl oder Alkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen;

20 jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

25 jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkenyl oder Halogenalkenyl-oxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxycarbonyl, Alkylsulfonyloxy, Hydroximinoalkyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen;

30 Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen,

5 oder einfach substituiert sein kann durch zweifach in ortho-Stellung verknüpftes Alkylen mit 3 oder 4 Kohlenstoffatomen oder Dioxyalkylen mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen, wobei diese Reste einfach bis vierfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen.

10 R⁴ steht bevorzugt für gegebenenfalls durch Halogen und/oder Cyano substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen,

für gegebenenfalls durch Halogen und/oder Cyano substituiertes Alkenyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen,

15 für gegebenenfalls durch Halogen und/oder Cyano substituiertes Alkinyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen oder

20 für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Aralkyl mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen im Arylteil und 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Arylteil und 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht,

X steht bevorzugt für Fluor, Chlor oder Brom.

n steht bevorzugt für 0, 1 oder 2.

25 R¹ steht besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxymethyl, 2-Methoxy-ethyl, Methylthio-methyl, 2-Methylthio-methyl, Hydroximino-methyl, Methoximino-methyl, Acetymethyl, 2-(Hydroximino)-propyl, 2-(Methoximino)propyl,

30 oder

für 2-Ethoxycarbonyl-ethyl, 2-Vinyloxy-ethyl, 2-Hydroxyimino-ethyl, 2-Methoxyimino-ethyl, 2-Hydroxyethyl, 2-Chlorethyl, 2-Methyl-1-propyl, 1,2-Dimethylpropyl, Thienylmethyl, amino;

5

oder

für Allyl, 2-Methyl-prop-2-enyl, Propargyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 1-(Trifluor-methyl)-ethyl, 3,3,3-Trifluorpropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropyl-methyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl oder Cyclohexylmethyl,
10 Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Allyloxy, Propargyloxy, Cyclopropyloxy, Cyclobutyloxy, Cyclopentyloxy oder Cyclo-hexyloxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluor-ethoxy, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, n-, i-, s- oder t-
15 Butylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Trifluorethylamino, Cyclohexyl-methylamino, 2-Cyanethylamino, Allylamino, 1-Cyclopropylethylamino, Cyclopropylamino, Cyclobutylamino, Cyclopentylamino, Cyclohexylamino, 1-Methylethylidenamino, Benzyloxy, Piperidinyl, Morpholinyl, Pyridyl-methoxy, Thiazolylmethoxy oder für -S-R⁵ steht, worin

20

R⁵ für Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Difluormethyl, Difluorchlor-methyl, Dichlorfluormethyl oder Trifluormethyl steht,

25

wobei die zuvor genannten Thiazolyl- und Pyridyl-Reste im Falle von Thia-zolyl einfach oder zweifach und im Falle von Pyridyl einfach bis dreifach, jeweils gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Dichlorfluor-methylthio, Trifluormethylthio und/oder Phenyl,

und wobei das zuvor genannte Benzyloxy im Phenylteil einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch

5 Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, Tri-

10 fluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Tri-
 fluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Methyl-
 amino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino,
 Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methyl-
 sulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl,
 15 Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl, Ethoximino-
 ethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl,

oder einfach substituiert sein kann durch zweifach in ortho-Stellung ver-
knüpftes Propan-1,3-diyyl, Methylendioxy oder Ethylendioxy, wobei diese
20 Reste einfach bis vierfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein
können durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl und/oder Tri-
fluormethyl,

25 R² steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl,
 n-, i-, s- oder t-Butyl, Cyclopropyl, Methoxy-methyl, 2-Methoxy-ethyl,
 Methylthio-methyl, 2-Methylthio-methyl, Hydroximino-methyl, Methox-
 imino-methyl, Acetymethyl, 2-Hydroximino-propyl, 2-Methoximino-propyl,

oder

30

- 15 -

für Allyl, Propargyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 1-(1,1,1-Trifluormethyl)ethyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl oder Cyclohexylmethyl.

5 R¹ und R² stehen besonders bevorzugt gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind,

für gegebenenfalls durch Methyl, Ethyl oder Trifluorethyl substituiertes Pyrrolyl, Piperidinyl, Morpholinyl oder Piperazinyl,

10 für einfach bis dreifach durch Fluor, Chlor, Brom, Hydroxy, Oxo, Methoxy, Amino, Methylamino, Dimethylamino, Acetylamino, Chlormethyl, Dichlor-methyl, Fluormethyl, Trifluormethyl, Aminomethyl, Methoxycarbonyl, Methylcarbonyl, Morpholinyl, 1,3-Dioxolanyl, tert.-Butoxycarbonylamino 15 substituiertes Piperidinyl,

für durch Phenyl anelliertes Piperidinyl,

20 für unsubstituiertes oder einfach bis dreifach durch Hydroxy, Dimethylaminom, Acetylamino, 1,3-Propandiyl substituiertes Pyrrolidinyl,

für unsubstituiertes oder durch Methyl substituiertes Piperazin, Tetrahydro-thiazin oder Tetrahydropyridin.

25 R³ steht besonders bevorzugt für Phenyl steht, das einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch

Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Formyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Allyl, Propargyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, 30 Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Allyloxy, Propargyloxy, Trifluormethyl,

5 Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Tri-
fluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio,
Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trichlorethinyloxy, Trifluor-
ethinyloxy, Chlorallyloxy, Iodpropargyloxy, Methylamino, Ethylamino, n-
oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl,
Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Hydroximinomethyl, Hydrox-
iminoethyl, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl,
Ethoximinoethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl.

10 oder einfach substituiert sein kann durch zweifach in ortho-Stellung verknüpftes Propan-1,3-diyl, Methylendioxy oder Ethylenedioxy, wobei diese Reste einfach bis vierfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n-Propyl i-Propyl und/oder Trifluormethyl,

R^4 steht besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Allyl, Propargyl, Benzyl oder Chlorbenzyl.

X steht besonders bevorzugt für Fluor oder Chlor

20

Ganz besonders bevorzugt sind diejenigen Verbindungen der Formel (1), in denen

R^1 , R^2 , R^4 , X und n die zuvor genannten bevorzugten Bedeutungen haben und

25 R³ für 2-substituiertes, 2,4-disubstituiertes, 2,6-disubstituiertes oder 2,4,6-trisubstituiertes Phenyl steht.

Ganz besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I), in denen

30 R⁴ für Methyl und

X für Chlor steht und

R¹, R², R³ und n die vorstehend genannten Bedeutungen haben.

5 Ganz besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I), in denen

R¹ und R² gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an welches sie gebunden sind, für gegebenenfalls substituiertes Piperidinyl stehen, wobei die möglichen Substituenten bereits vorstehend erwähnt werden und

10

R³, R⁴, X und n die vorstehend genannten Bedeutungen haben.

Ganz besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I), in denen

15 R² für Wasserstoff, Methyl, Ethyl oder iso-Propyl steht und

R¹, R³, R⁴, X und n eine der vorstehend genannten Bedeutungen haben.

Die zuvor genannten Reste-Definitionen können untereinander in beliebiger Weise

20 kombiniert werden. Außerdem können auch einzelne Bedeutungen entfallen.

Bevorzugte erfindungsgemäße Verbindungen sind auch Additionsprodukte aus Säuren und denjenigen Triazolopyrimidinen der Formel (I), in denen

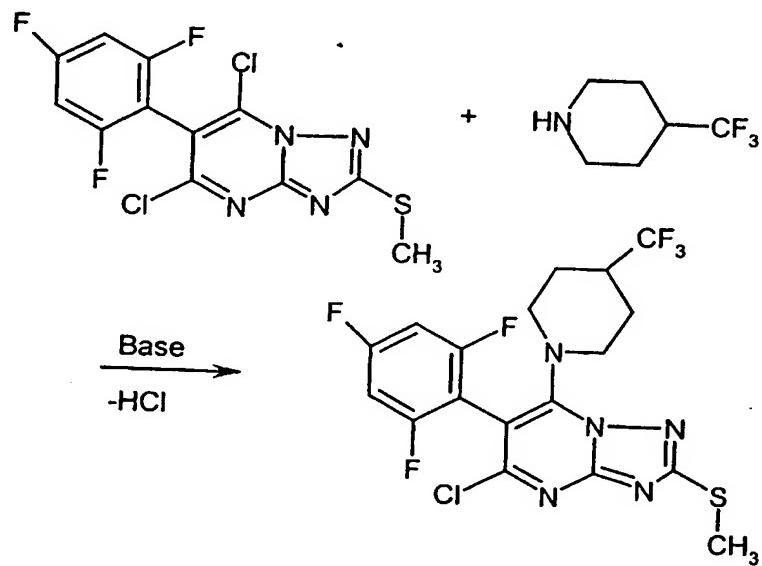
25 R¹ für Amino steht und

R², R³, R⁴, X und n diejenigen Bedeutungen haben, die für diese Reste bzw. den Index n als bevorzugt genannt wurden.

30 Zu den Säuren, die addiert werden können, gehören vorzugsweise Halogenwasserstoffsäuren, wie z.B. die Chlorwasserstoffsäure und die

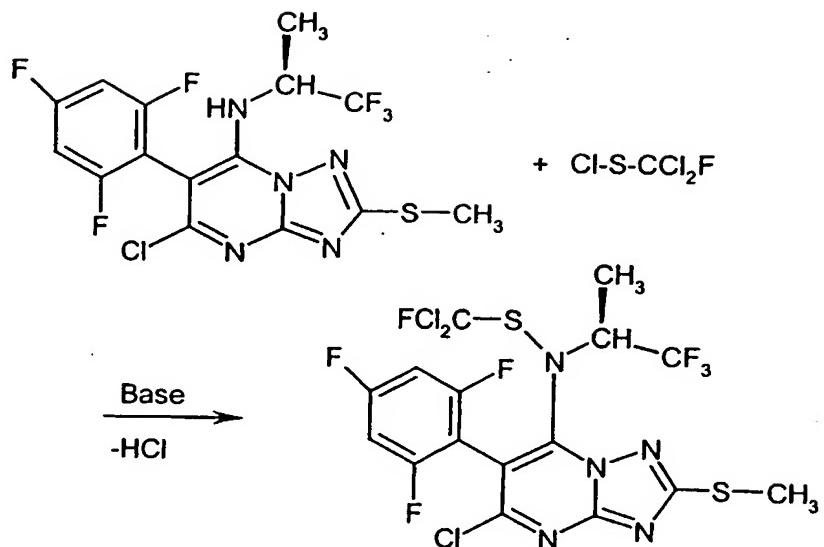
Bromwasserstoffsäure, insbesondere die Chlorwasserstoffsäure, ferner Phosphorsäure, Salpetersäure, mono- und bifunktionelle Carbonsäuren und Hydroxycarbonsäuren, wie z.B. Essigsäure, Maleinsäure, Bernsteinsäure, Fumarssäure, Weinsäure, Zitronensäure, Salicylsäure, Sorbinsäure und Milchsäure, sowie Sulfonsäuren, wie z.B. p-Toluolsulfonsäure, 1,5-Naphthalindisulfonsäure, Saccharin und Thiosaccharin.

Verwendet man 5,7-Dichlor-2-(methylsulfanyl)-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]pyrimidin und 4-Trifluormethyl-piperidin als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



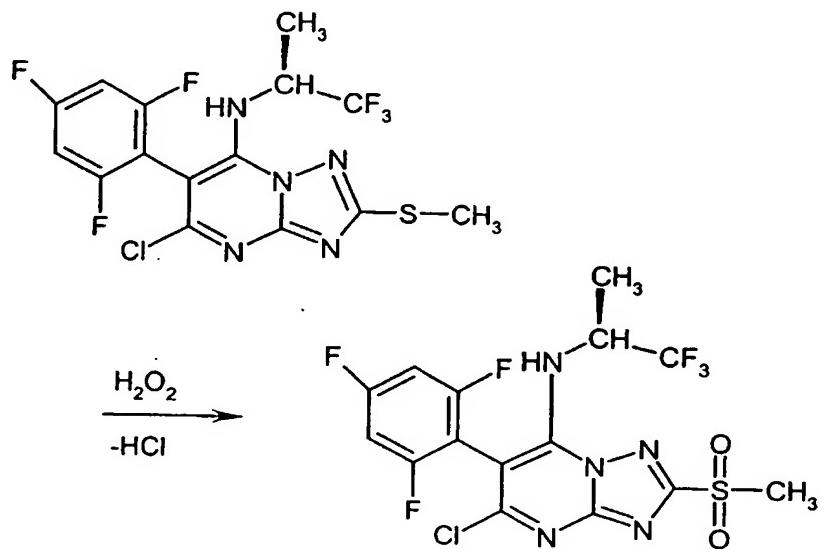
Verwendet man 5-Chlor-2-(methylsulfanyl)-N-[(1S)-2,2,2-trifluor-1-methyl-ethyl]-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]pyrimidin-7-amin und Dichlorfluor-methan-sulfenylchlorid als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

- 19 -



Verwendet man 5-Chlor-2-(methyl-sulfanyl)-N-[(1S)-2,2,2-trifluor-1-methyl-ethyl]-6-(2,4,6-trifluorophenyl)-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-amin als Ausgangsstoff und einen Überschuss an Wasserstoffperoxid als Oxidationsmittel, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden:

5



- 20 -

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als Ausgangsstoffe benötigten Dihalogen-triazolo-pyrimidine sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In dieser Formel haben R³, R⁴ und X vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt genannt wurden. Y¹ steht vorzugsweise für Fluor, Chlor oder Brom, besonders bevorzugt für Fluor oder Chlor.

5

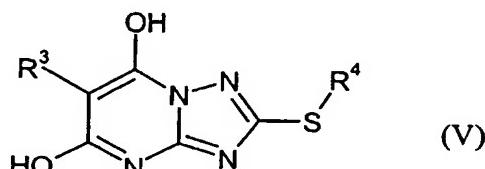
Die Dihalogen-triazolopyrimidine der Formel (II) sind neu. Auch diese Stoffe eignen sich zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen.

10

Die Dihalogen-triazolopyrimidine lassen sich herstellen, indem man

d) Dihydroxy-triazolo-pyrimidine der Formel

15



in welcher

R³ und R⁴ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

20

mit Halogenierungsmitteln, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

25

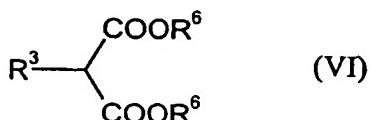
Die bei der Durchführung des Verfahrens (d) als Ausgangsstoffe benötigten Dihydroxy-triazolopyrimidine sind durch die Formel (V) allgemein definiert. In dieser Formel haben R³ und R⁴ vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt genannt wurden.

- 21 -

Auch die Dihydroxy-triazolopyrimidine der Formel (V) sind bisher noch nicht bekannt. Sie lassen sich herstellen, indem man

e) Arylmalonester der Formel

5



in welcher

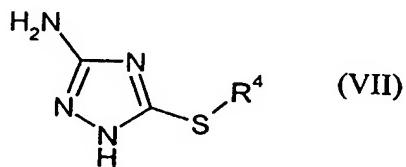
R^3 die oben angegebenen Bedeutungen hat und

10

R^6 für Alkyl steht mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,

mit Aminotriazolen der Formel

15



in welcher

R^4 die oben angegebenen Bedeutungen hat,

20

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umsetzt.

25

Die bei der Durchführung des Verfahrens (e) als Ausgangsstoffe benötigten Arylmalonester sind durch die Formel (VI) allgemein definiert. In dieser Formel hat R^3 vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diesen Rest als bevorzugt genannt wurden. R^6 steht vorzugsweise für Methyl oder Ethyl.

Die Arylmalonester der Formel (VI) sind bekannt oder lassen sich nach bekannten Methoden herstellen (vgl. US-A 6 156 925).

5 Die bei der Durchführung des Verfahrens (e) weiterhin als Ausgangsstoffe benötigten Aminotriazole sind durch die Formel (VII) allgemein definiert. In dieser Formel hat R⁴ vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diesen Rest als bevorzugt genannt wurden.

10

Die Aminotriazole der Formel (VII) sind bekannt oder können nach bekannten Methoden hergestellt werden (vgl. J. Heterocycl. Chem. (1982), 19(5), 1157-64).

15 Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des Verfahrens (e) alle für derartige Umsetzungen üblichen, inerten organischen Solventien infrage. Vorzugsweise verwendbar sind Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, i-Propanol, n-Butanol und tert.-Butanol.

20 Als Säurebindemittel kommen bei der Durchführung des Verfahrens (e) alle für derartige Umsetzungen üblichen anorganischen und organischen Basen in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind tertiäre Amine, wie Tributylamin oder Pyridin. Im Überschuss eingesetztes Amin kann auch als Verdünnungsmittel fungieren.

25 Die Temperaturen können bei der Durchführung des Verfahrens (e) in einem größeren Bereich variiert werden. Im Allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 20°C und 200°C, vorzugsweise zwischen 50°C und 180°C.

Bei der Durchführung des Verfahrens (e) arbeitet man im Allgemeinen unter Atmosphärendruck. Es ist allerdings auch möglich, unter erhöhtem oder verminderter Druck zu arbeiten.

Bei der Durchführung des Verfahrens (e) setzt man Arylmalonester der Formel (VI) und Aminotriazol der Formel (VII) im Allgemeinen in äquimolaren Mengen um. Es ist aber auch möglich, die eine oder andere Komponente in einem Überschuss zu verwenden. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.

5

Als Halogenierungsmittel kommen bei der Durchführung des Verfahrens (d) alle für den Ersatz von Hydroxygruppen durch Halogen üblichen Komponenten in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Phosphortrichlorid, Phosphotribormid, Phosphor-pentachlorid, Phosphoroxychlorid, Thionylchlorid, Thionylbromid oder deren Gemische. Die entsprechenden Fluor-Verbindungen der Formel (II) lassen sich aus den Chlor- oder Brom-Verbindungen durch Umsetzung mit Kaliumfluorid herstellen.

10 Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des Verfahrens (d) alle für derartige Halogenierungen üblichen Solventien infrage. Vorzugsweise verwendbar sind halogenierte aliphatische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzol. Als Verdünnungsmittel kann aber auch das Halogenierungsmittel selbst, z.B. Phosphoroxychlorid oder ein Gemisch von Halogenierungsmitteln fungieren.

15 Die Temperaturen können auch bei der Durchführung des Verfahrens (d) in einem größeren Bereich variiert werden. Im Allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise zwischen 10°C und 120°C.

20 Bei der Durchführung des Verfahrens (d) arbeitet man im Allgemeinen unter Atmosphärendruck. Es ist aber auch möglich, unter erhöhtem Druck zu arbeiten.

25

Bei der Durchführung des Verfahrens (d) setzt man Dihydroxy-triazolopyrimidin der Formel (V) im Allgemeinen mit einem Überschuss an Halogenierungsmittel um. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.

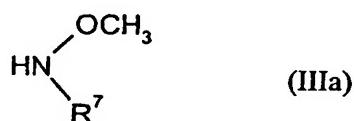
30

Die weiterhin zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als Ausgangsstoffe benötigten Amine sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In

ieser Formel (III) haben R¹ und R² vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für R¹ und R² als bevorzugt angegeben wurden.

5 Die Amine der Formel (III) sind teilweise bekannt.

Neu sind Amine der Formel



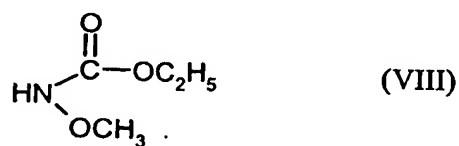
10

in welcher

R⁷ für Isobutyl, 2-Methoxyethyl oder für —CH₂—C(CH₃)=CH₂ steht.

15 Die Amine der Formel (IIIa) lassen sich herstellen, indem man

f) in einer ersten Stufe N-Methoxycarbaminsäure-ethylester der Formel



20

mit Halogenverbindungen der Formel

$$R^7 \cdot X^1 \quad (IX)$$

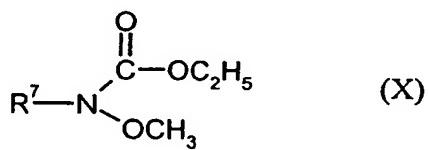
25 in welcher

- 25 -

R⁷ die oben angegebenen Bedeutungen hat und

X¹ für Brom oder Iod steht,

5 in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt und die entstehenden Carbamate der Formel



10 in welcher

R⁷ die oben angegebenen Bedeutungen hat,

15 in einer zweiten Stufe mit Kaliumhydroxid in Gegenwart von Ethanol und Wasser umsetzt.

Neu sind auch Amine der Formel



20

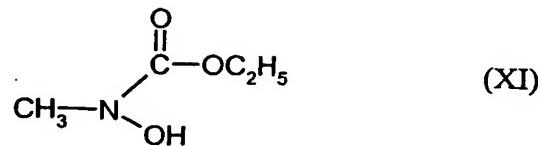
in welcher

R⁷ die oben angegebenen Bedeutungen hat.

25 Die Amine der Formel (IIIb) lassen sich herstellen, indem man

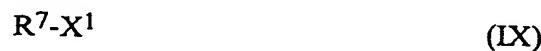
- 26 -

g) in einer ersten Stufe N-Hydroxy-N-methyl-carbaminsäure-ethylester der Formel



5

mit Halogenverbindungen der Formel



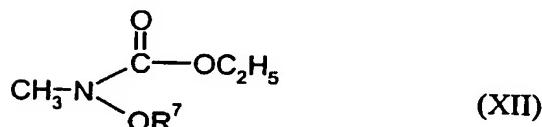
10

in welcher

R^7 und X^1 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

15

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt und die entstehenden Carbamate der Formel



20

in welcher

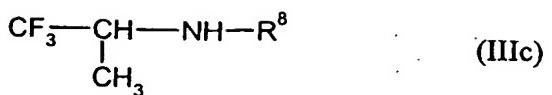
R^7 die oben angegebenen Bedeutungen hat,

in einer zweiten Stufe mit Kaliumhydroxid in Gegenwart von Ethanol und Wasser umsetzt.

25

Neu sind auch Trifluorisopropylamine der Formel

- 27 -



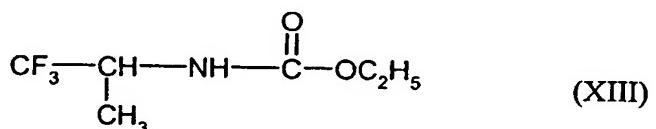
in welcher

5 R⁸ für Methyl, Ethyl oder Propyl steht.

Die Trifluorisopropylamine der Formel (IIIc) lassen sich herstellen, indem

h) in einer ersten Stufe N-Trifluorisopropyl-carbaminsäure-ethylester der Formel

10



mit Halogenverbindungen der Formel

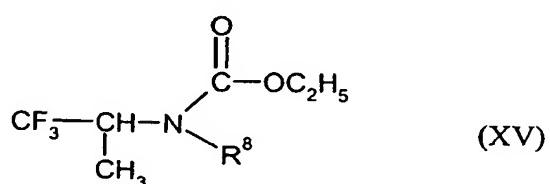
15



in welcher

R⁸ und X¹ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

20

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt
und die entstehenden Carbamate der Formel

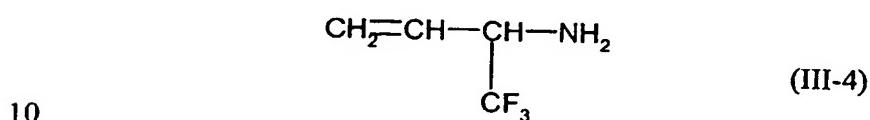
25

in welcher

R⁸ die oben angegebenen Bedeutungen hat,

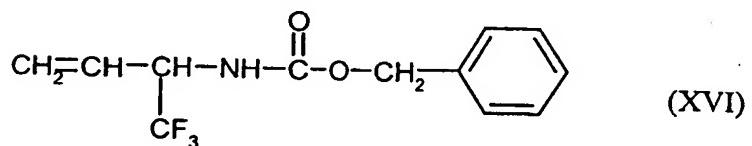
5 in einer zweiten Stufe mit Kaliumhydroxid in Gegenwart von Ethanol und Wasser umsetzt.

Neu ist schließlich auch das 3-Trifluormethyl-3-amino-propen der Formel



Das 3-Trifluormethyl-3-amino-propen der Formel (IIId) lässt sich herstellen, indem man

15 (i) das Carbamat der Formel



mit wässriger Salzsäure umsetzt.

20

Die bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (f) – (i) als Ausgangsstoffe benötigten Verbindungen der Formeln (VIII), (IX), (XI), (XIII), (XIV) und (XVI) sind bekannt oder lassen sich nach bekannten Methoden herstellen.

25 Bei der Durchführung der ersten Stufe der erfindungsgemäßen Verfahren (f), (g) und (h) kommen jeweils alle für derartige Umsetzungen üblichen anorganischen und organischen Säureakzeptoren in Frage.

Bei der Durchführung der ersten Stufe der erfindungsgemäßen Verfahren (f), (g) und (h) kommen jeweils alle für derartige Umsetzungen üblichen anorganischen und organischen Säureakzeptoren in Frage.

5

Vorzugsweise verwendbar sind Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Natrium-methylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat und Natriumhydrogencarbonat, und ausserdem Ammonium-Verbindungen, wie Ammoniumhydroxid, Ammoniumacetat und Ammoniumcarbonat. Als organische Basen seien genannt: tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

20

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung der ersten Stufe der erfindungsgemäßen Verfahren (f), (g) und (h) jeweils alle üblichen inerten organischen Solventien in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Ether, wie Diethylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid oder N-Methylpyrrolidon; Sulfone, wie Sulfolan; Alkohole wie Methanol, Ethanol, Isopropanol, tert.Butanol, n-Butanol.

25

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der ersten Stufe der erfindungsgemäßen Verfahren (f), (g) und (h) jeweils innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im Allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise zwischen 10°C und 100°C.

30

- 30 -

Bei der Durchführung der ersten Stufe der erfindungsgemäßen Verfahren (f), (g) und (h) arbeitet man im Allgemeinen jeweils unter Atmosphärendruck. Es ist jedoch auch möglich, unter erhöhtem Druck oder, sofern keine niedrig siedenden Komponenten an der Umsetzung beteiligt sind, unter verminderter Druck zu arbeiten.

5

Bei der Durchführung der ersten Stufe der erfindungsgemäßen Verfahren (f), (g) und (h) setzt man

10 • auf 1 mol an N-Methoxy-carbaminsäure-ethylester der Formel (VIII) im Allgemeinen 0,5 bis 15 mol, vorzugsweise 1 bis 5 mol an Halogenverbindung der Formel (IX) ein, bzw.

15 • auf 1 mol an N-Hydroxy-N-methyl-carbaminsäure-ethylester der Formel (XI) im Allgemeinen 0,5 bis 15 mol, vorzugsweise 1 bis 5 mol an Halogenverbindung der Formel (IX) ein, bzw.

20 • auf 1 mol an N-Trifluorisopropyl-carbaminsäure-ethylester der Formel (XIII) im Allgemeinen 0,5 bis 15 mol, vorzugsweise 1 bis 5 mol an Halogenverbindung der Formel (XIV) ein.

25

Die Aufarbeitung erfolgt jeweils nach üblichen Methoden, beispielsweise durch Extraktion und anschließende Trocknung oder durch Fällung mit anschließender Filtration und Trocknung. Gegebenenfalls noch vorhandene Verunreinigungen können nach üblichen Methoden entfernt werden.

25

Die bei der Durchführung der ersten Stufe der erfindungsgemäßen Verfahren (f), (g) und (h) als Zwischenprodukte erhaltenen Verbindungen der Formeln (X), (XII) und (XV) sind neu.

30

Auch bei der Durchführung der zweiten Stufe der erfindungsgemäßen Verfahren (f), (g) und (h) können die Reaktionstemperaturen jeweils innerhalb eines größeren

Bereiches variiert werden. Im Allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 100°C, vorzugsweise zwischen 10°C und 80°C.

5 Auch bei der Durchführung der zweiten Stufe der erfindungsgemäßen Verfahren (f), (g) und (h) arbeitet man im Allgemeinen jeweils unter Atmosphärendruck. Es ist jedoch wiederum möglich, jeweils auch unter erhöhtem Druck oder, sofern die zu isolierenden Produkte keine sehr niedrigen Siedepunkt aufweisen, unter verminderterem Druck zu arbeiten.

10 Bei der Durchführung der zweiten Stufe der erfindungsgemäßen Verfahren (f), (g) und (h) setzt man auf 1 mol an einer Verbindung der Formel (X), (XII) oder (XV) jeweils einen Überschuß, vorzugsweise bis zu 10 mol an Kaliumhydroxid ein. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Dabei werden die Amine zweckmäßigerweise im Allgemeinen durch Hinzufügen von Säure, vorzugsweise 15 wässriger Salzsäure, in Form ihrer Salze isoliert.

20 Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (i) können die Reaktionstemperaturen ebenfalls in einem größeren Bereich variiert werden. Im Allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 10°C und 150°C, vorzugsweise bei Rückflußtemperatur.

25 Im Allgemeinen arbeitet man bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (i) unter Atmosphärendruck. Es ist aber auch möglich, unter erhöhtem Druck zu arbeiten.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (i) setzt man auf 1 mol an Carbamat der Formel (XVI) einem Überschuß, vorzugsweise bis zu 10 mol an wässriger Salzsäure ein. Die Aufarbeitung erfolgt wiederum nach üblichen Methoden.

Die bei der Durchfhrung des erfundungsgem en Verfahrens (b) als Ausgangsstoffe bentigten Triazolopyrimidine sind durch die Formel (Ia) allgemein definiert. In dieser Formel haben R², R³, R⁴ und X vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfundungsgem en Stoffe der Formel (I) fr diese Reste als bevorzugt genannt wurden.

Bei den Triazolopyrimidinen der Formel (Ia) handelt es sich um erfundungsgemäße Stoffe. Sie lassen sich nach dem erfundungsgemäßen Verfahren (a) herstellen.

10 Die weiterhin zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) als Ausgangsstoffe benötigten Sulfensäurehalogenide sind durch die Formel (IV) allgemein definiert. In dieser Formel hat R⁵ vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diesen Rest als bevorzugt genannt wurden.

15

Y^2 steht vorzugsweise für Fluor, Chlor oder Brom, besonders bevorzugt für Chlor.

20 Die Sulfensäurehalogenide der Formel (IV) sind bekannt oder lassen sich nach bekannten Methoden herstellen

25 Die bei der Durchfhrung des erfindungsgemen Verfahrens (c) als Ausgangsstoffe benötigten Triazolopyrimidine sind durch die Formel (Ib) allgemein definiert. In dieser Formel haben R¹, R², R³, R⁴ und X vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemen Stoffe der Formel (I) fr diese Reste als bevorzugt genannt wurden.

30

- Als Oxidationsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) alle üblichen, zur Abgabe von Sauerstoff geeigneten Substanzen in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Wasserstoffperoxid, dessen Salze und dessen Addukte mit z.B. Harnstoff, außerdem t-Butylperoxid, Persäuren oder deren Salze, wie Perameisensäure, Peressigsäure, Perpropionsäure, Perbenzoësäure, 3-Chlorperbenzoësäure, Kaliumhydrogenpersulfat, Kaliumperoxodisulfat, Natriumperborat, Natriumpercarbonat oder Natriumperoxodisulfat, weiterhin auch Kaliumpermanganat, oder Natriumperrhenat, ferner auch chlorige- oder hypochlorige Säure oder deren Metallsalzlösungen in Wasser.
- 10 Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) alle üblichen, inerten organischen Solventien in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Hexan, Heptan, Cyclohexan oder Toluol; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2- Dimethoxyethan oder 1,2-Diethoxyethan; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid oder N-Methylpyrrolidon; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid; Sulfone, wie Sulfolan.
- 15 20 Als Säureakzeptoren kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) alle für derartige Umsetzungen üblichen Säurebindemittel in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).
- 25 30 Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) in einem größeren Bereich variiert werden. Im Allgemeinen arbeitet

man bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen zwischen 0°C und 80°C.

5 Sowohl bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als auch des Verfahrens (b) arbeitet man im allgemeinen unter Atmosphärendruck. Es ist aber auch möglich, unter erhöhtem oder verminderem Druck, im allgemeinen zwischen 0,1 und 10 bar, zu arbeiten.

10 Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) setzt man auf 1 mol an Dihalogen-triazolo-pyrimidin der Formel (II) im allgemeinen 0,5 bis 10 mol, vorzugsweise 0,8 bis 2 mol an Amin der Formel (III) ein. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.

15 Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) alle üblichen, inerten organischen Solventien in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Ether, wie Diethylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid oder N-Methylpyrrolidon; Sulfone, wie Sulfolan.

20 Als Säureakzeptoren kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) alle für derartige Umsetzungen üblichen anorganischen und organischen Basen infrage. Vorzugsweise verwendbar sind Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Natrium-methylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogen-carbonat und Natriumhydrogencarbonat, und außerdem Ammonium-Verbindungen, wie Ammoniumhydroxid, Ammoniumacetat und Ammoniumcarbonat.

30

Auch bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) können die Reaktionstemperaturen innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -40°C und +120°C, vorzugsweise zwischen -20°C und +50°C.

5

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) setzt man auf 1 mol an Triazolopyrimidin der Formel (Ia) im Allgemeinen 1 bis 15 mol, vorzugsweise 1 bis 8 mol an Sulfensäurehalogenid der Formel (IV) ein. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.

10

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) alle für derartige Umsetzungen üblichen, inerten organischen Solventien infrage. Vorzugsweise verwendbar sind alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2- Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Ketone, wie Aceton, Butanon, Methyl-isobutylketon oder Cyclohexanon; Säuren, wie Ameisensäure, Essigsäure oder Propionsäure; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N, N-Dimethylformamid, N, N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid; Sulfone, wie Sulfolan; Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder i-Propanol, n-, i-, sek- oder tert-Butanol, Ethandiol, Propan-1,2-diol, Ethoxyethanol, Methoxyethanol, Diethylenglykolmono-methylether, Diethylenglykolmonoethylether, deren Gemische mit Wasser oder reines Wasser.

30 Als Katalysatoren kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) alle für derartige Umsetzungen üblichen Reaktionsbeschleuniger infrage. Vor-

zugswise verwendbar sind Salze von Metallen der IV., V. und VI. Nebengruppe des Periodensystems der Elemente. Als Beispiele hierfür seien Natrium(meta)vanadat, Natriummolybdat und Natriumwolframat genannt.

- 5 Das erfindungsgemäße Verfahren (c) kann in einer besonderen Variante auch in einem Zweiphasen wie beispielsweise Wasser/Toluol oder Wasser/Dichlormethan, gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Phasentransferkatalysators, durchgeführt werden. Als Beispiele für solche Katalysatoren seien genannt: Tetrabutylammonium-iodid, Tetrabutylammoniumbromid, Tetrabutylammoniumchlorid, Tributyl-methyl-phosphoniumbromid, Trimethyl-C₁₃/C₁₅-alkylammoniumchlorid, Trimethyl-C₁₃/C₁₅-alkylammoniumbromid, Dibenzyl-dimethyl-ammoniummethylsulfat, Dimethyl-C₁₂/C₁₄-alkyl-benzylammoniumchlorid, Dimethyl-C₁₂/C₁₄-alkyl-benzylammoniumbromid, Tetrabutylammoniumhydroxid, Triethylbenzylammoniumchlorid, Methyltrioctylammoniumchlorid, Trimethylbenzylammoniumchlorid, 15-Krone-5, 18-Krone-6
10 oder Tris-[2-(2-methoxyethoxy)-ethyl]-amin.
15

Die Reaktionstemperaturen können auch bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise zwischen 0°C und 80°C.
20

Auch bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) arbeitet man im Allgemeinen unter Atmosphärendruck. Es ist aber auch möglich, unter erhöhtem Druck zu arbeiten.
25

Ist bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) die Herstellung von Triazolopyrimidinen der Formel (I) beabsichtigt, in denen n für 1 steht, so setzt man auf 1 mol an Triazolopyridin der Formel (Ib) im Allgemeinen 1 bis 1,5 Äquivalente, vorzugsweise 1 bis 1,2 Äquivalente, an Oxidationsmittel ein.
30

Ist bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) die Herstellung von Triazolopyrimidinen der Formel (I) beabsichtigt, in denen n für 2 steht, so setzt man auf 1 mol an Triazolopyridin der Formel (Ib) im Allgemeinen 2 bis 10 Äquivalente, vorzugsweise 2 bis 5 Äquivalente, an Oxidationsmittel ein. Die Aufarbeitung erfolgt 5 jeweils nach üblichen Methoden.

Zur Herstellung von Säureadditions-Salzen von Triazolopyrimidinen der Formel (I) kommen vorzugsweise diejenigen Säuren in Frage, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Säureadditions-Salze als bevorzugte 10 Säuren genannt wurden.

Die Säureadditions-Salze der Verbindungen der Formel (I) können in einfacher Weise nach üblichen Salzbildungsmethoden, z.B. durch Lösen einer Verbindung der Formel (I) in einem geeigneten inerten Lösungsmittel und Hinzufügen der Säure, 15 z.B. Chlorwasserstoffsäure, erhalten werden und in bekannter Weise, z.B. durch Abfiltrieren, isoliert und gegebenenfalls durch Waschen mit einem inertnen organischen Lösungsmittel gereinigt werden.

Die erfindungsgemäßen Stoffe weisen eine starke mikrobizide Wirkung auf und 20 können zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, wie Fungi und Bakterien, im Pflanzenschutz und im Materialschutz eingesetzt werden.

Fungizide lassen sich Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes und 25 Deuteromycetes einsetzen.

Bakterizide lassen sich im Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae und Streptomycetaceae ein-setzen.

Beispielhaft aber nicht begrenzend seien einige Erreger von pilzlichen und bakteriellen Erkrankungen, die unter die oben aufgezählten Oberbegriffe fallen, genannt:

- 5 **Xanthomonas-Arten, wie beispielsweise *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*;**
- 10 **Pseudomonas-Arten, wie beispielsweise *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*;**
- 15 **Erwinia-Arten, wie beispielsweise *Erwinia amylovora*;**
- 20 **Pythium-Arten, wie beispielsweise *Pythium ultimum*;**
- Phytophthora-Arten, wie beispielsweise *Phytophthora infestans*;**
- 25 **Pseudoperonospora-Arten, wie beispielsweise *Pseudoperonospora humuli* oder
 Pseudoperonospora cubensis;**
- Plasmopara-Arten, wie beispielsweise *Plasmopara viticola*;**
- 30 **Bremia-Arten, wie beispielsweise *Bremia lactucae*;**
- Peronospora-Arten, wie beispielsweise *Peronospora pisi* oder *P. brassicae*;**
- Erysiphe-Arten, wie beispielsweise *Erysiphe graminis*;**
- Sphaerotheca-Arten, wie beispielsweise *Sphaerotheca fuliginea*;**
- Podosphaera-Arten, wie beispielsweise *Podosphaera leucotricha*;**
- Venturia-Arten, wie beispielsweise *Venturia inaequalis*;**

Pyrenophora-Arten, wie beispielsweise *Pyrenophora teres* oder *P. graminea*

(Konidienform: Drechslera, Syn: *Helminthosporium*);

5 Cochliobolus-Arten, wie beispielsweise *Cochliobolus sativus*

(Konidienform: Drechslera, Syn: *Helminthosporium*);

10 Uromyces-Arten, wie beispielsweise *Uromyces appendiculatus*;
Puccinia-Arten, wie beispielsweise *Puccinia recondita*;

Sclerotinia-Arten, wie beispielsweise *Sclerotinia sclerotiorum*;

15 Tilletia-Arten, wie beispielsweise *Tilletia caries*;
Ustilago-Arten, wie beispielsweise *Ustilago nuda* oder *Ustilago avenae*;

20 Pellicularia-Arten, wie beispielsweise *Pellicularia sasakii*;
Pyricularia-Arten, wie beispielsweise *Pyricularia oryzae*;

Fusarium-Arten, wie beispielsweise *Fusarium culmorum*;

25 Botrytis-Arten, wie beispielsweise *Botrytis cinerea*;
Septoria-Arten, wie beispielsweise *Septoria nodorum*;
Leptosphaeria-Arten, wie beispielsweise *Leptosphaeria nodorum*;
30 Cercospora-Arten, wie beispielsweise *Cercospora canescens*;

Alternaria-Arten, wie beispielsweise Alternaria brassicae;

Pseudocercospora-Arten, wie beispielsweise Pseudocercospora herpotrichoides.

- 5 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe weisen auch eine sehr gute stärkende Wirkung in Pflanzen auf. Sie eignen sich daher zur Mobilisierung pflanzeneigener Abwehrkräfte gegen Befall durch unerwünschte Mikroorganismen.

- 10 Unter pflanzenstärkenden (resistenzinduzierenden) Stoffen sind im vorliegenden Zusammenhang solche Substanzen zu verstehen, die in der Lage sind, das Abwehrsystem von Pflanzen so zu stimulieren, dass die behandelten Pflanzen bei nachfolgender Inokulation mit unerwünschten Mikroorganismen weitgehende Resistenz gegen diese Mikroorganismen entfalten.

- 15 Unter unerwünschten Mikroorganismen sind im vorliegenden Fall phytopathogene Pilze, Bakterien und Viren zu verstehen. Die erfindungsgemäßen Stoffe können also eingesetzt werden, um Pflanzen innerhalb eines gewissen Zeitraumes nach der Behandlung gegen den Befall durch die genannten Schaderreger zu schützen. Der Zeitraum, innerhalb dessen Schutz herbeigeführt wird, erstreckt sich im allgemeinen von 1 bis 10 Tage, vorzugsweise 1 bis 7 Tage nach der Behandlung der Pflanzen mit den Wirkstoffen.

- 20
25 Die gute Pflanzenverträglichkeit der Wirkstoffe in den zur Bekämpfung von Pflanzenkrankheiten notwendigen Konzentrationen erlaubt eine Behandlung von oberirdischen Pflanzenteilen, von Pflanz- und Saatgut, und des Bodens.

Dabei lassen sich die erfindungsgemäßen Wirkstoffe mit besonders gutem Erfolg zur Bekämpfung von Krankheiten im Wein-, Obst- und Gemüseanbau, wie beispielsweise gegen Venturia- oder Podosphaera-Arten, einsetzen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Steigerung des Ernteertrages. Sie sind außerdem mindertoxisch und weisen eine gute Pflanzenverträglichkeit auf.

5 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können in bestimmten Konzentrationen und Aufwandmengen auch als Herbizide, zur Beeinflussung des Pflanzenwachstums, sowie zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen verwendet werden. Sie lassen sich gegebenenfalls auch als Zwischen- und Vorprodukte für die Synthese weiterer Wirkstoffe einsetzen.

10 Mit den erfindungsgemäßen Wirkstoffen können Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch Sortenschutzrechte schützbaren oder nicht schützbaren Pflanzensorten. Unter Pflanzenteilen sollen alle oberirdischen und unterirdischen Teile und Organe der Pflanzen, wie Sproß, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden werden, wobei beispielhaft Blätter, Nadeln, Stengel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und Samen sowie Wurzeln, Knollen und Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, beispielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen.

25 Die Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den erfindungsgemäßen Wirkstoffen erfolgt direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder Lagerraum nach den üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Samen, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges Umhüllen.

Im Materialschutz lassen sich die erfindungsgemäßen Stoffe zum Schutz von technischen Materialien gegen Befall und Zerstörung durch unerwünschte Mikroorganismen einsetzen.

- 5 Unter technischen Materialien sind im vorliegenden Zusammenhang nichtlebende Materialien zu verstehen, die für die Verwendung in der Technik zubereitet worden sind. Beispielsweise können technische Materialien, die durch erfindungsgemäße Wirkstoffe vor mikrobieller Veränderung oder Zerstörung geschützt werden sollen, Klebstoffe, Leime, Papier und Karton, Textilien, Leder, Holz, Anstrichmittel und Kunststoffartikel, Kühlschmierstoffe und andere Materialien sein, die von Mikroorganismen befallen oder zersetzt werden können. Im Rahmen der zu schützenden Materialien seien auch Teile von Produktionsanlagen, beispielsweise Kühlwasserkreisläufe, genannt, die durch Vermehrung von Mikroorganismen beeinträchtigt werden können. Im Rahmen der vorliegenden Erfindung seien als technische Materialien vorzugsweise Klebstoffe, Leime, Papiere und Kartone, Leder, Holz, Anstrichmittel, Kühlschmiermittel und Wärmeübertragungsflüssigkeiten genannt, besonders bevorzugt Holz.
- 10 15
- 20 Als Mikroorganismen, die einen Abbau oder eine Veränderung der technischen Materialien bewirken können, seien beispielsweise Bakterien, Pilze, Hefen, Algen und Schleimorganismen genannt. Vorzugsweise wirken die erfindungsgemäßen Wirkstoffe gegen Pilze, insbesondere Schimmelpilze, holzverfärbende und holzzerstörende Pilze (Basidiomyceten) sowie gegen Schleimorganismen und Algen.
- 25 Es seien beispielsweise Mikroorganismen der folgenden Gattungen genannt:
- 30 Alternaria, wie Alternaria tenuis,
- Aspergillus, wie Aspergillus niger,
- Chaetomium, wie Chaetomium globosum,

- Coniophora, wie Coniophora puetana,
- Lentinus, wie Lentinus tigrinus,
- 5 Penicillium, wie Penicillium glaucum,
- Polyporus, wie Polyporus versicolor,
- 10 Aureobasidium, wie Aureobasidium pullulans,
- Sclerophoma, wie Sclerophoma pityophila,
- Trichoderma, wie Trichoderma viride,
- 15 Escherichia, wie Escherichia coli,
- Pseudomonas, wie Pseudomonas aeruginosa,
- 20 Staphylococcus, wie Staphylococcus aureus.
- Die Wirkstoffe können in Abhängigkeit von ihren jeweiligen physikalischen und/oder chemischen Eigenschaften in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Schäume, Pasten, Granulate, Aerosole, Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen und in Hüllmassen für Saatgut, sowie 25 ULV-Kalt- und Warmnebel-Formulierungen.
- Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden 30 verflüssigten Gasen und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln

und/oder schaumerzeugenden Mitteln. Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie XyloL, Toluol oder Alkynaphthaline, chlorierte Aromaten oder chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, Alkohole, wie Butanol oder Glycol sowie deren Ether und Ester, Ketone, wie Aceton, Methylethyleketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser. Mit verflüssigten gasförmigen Streckmitteln oder Trägerstoffen sind solche Flüssigkeiten gemeint, welche bei normaler Temperatur und unter Normaldruck gasförmig sind, z.B. Aerosol-Treibgase, wie Halogenkohlenwasserstoffe sowie Butan, Propan, Stickstoff und Kohlendioxid. Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate. Als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnusschalen, Maiskolben und Tabakstengel. Als Emulgier und/oder schaumerzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäureester, Polyoxyethylen-Fettalkoholether, z.B. Alkylarylpolyglycolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate. Als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulverige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine, und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

- 45 -

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurennährstoffe, wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

5

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

10 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Fungiziden, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden oder Insektiziden verwendet werden, um so z.B. das Wirkungsspektrum zu verbreitern oder Resistenzentwicklungen vorzubeugen. In vielen Fällen erhält man dabei synergistische Effekte, d.h. die Wirksamkeit der Mischung ist größer als die Wirksamkeit der Einzelkomponenten.

15

Als Mischpartner kommen zum Beispiel folgende Verbindungen infrage:

Fungizide:

20 Aldimorph, Ampropylfos, Ampropylfos-Kalium, Andoprim, Anilazin, Azaconazol, Azoxystrobin,

25 Benalaxyd, Benodanil, Benomyl, Benzamacril, Benzamacryl-isobutyl, Bialaphos, Binapacryl, Biphenyl, Bitertanol, Blasticidin-S, Bromuconazol, Bupirimat, Buthiobat,

Calciumpolysulfid, Capsimycin, Captafol, Captan, Carbendazim, Carboxin, Carvon, Chinomethionat (Quinomethionat), Chlobenthiazon, Chlorfeniazol, Chloroneb, Chloropicrin, Chlorothalonil, Chlozolinat, Clozylacon, Cufraneb, Cymoxanil, Cyproconazol, Cyprodinil, Cyprofuram, Carpropamid,

30

Debacarb, Dichlorophen, Diclobutrazol, Diclofuanid, Diclomezin, Dicloran, Diethofencarb, Difenoconazol, Dimethirimol, Dimethomorph, Diniconazol, Diniconazol-M, Dinocap, Diphenylamin, Dipyrithione, Ditalimfos, Dithianon, Dodemorph, Dodine, Drazoxolon,

5

Ediphenphos, Epoxiconazol, Etaconazol, Ethirimol, Etridiazol

10 Famoxadon, Fenapanil, Fenarimol, Fenbuconazol, Fenfuram, Fenitropan, Fenpiclonil, Fenpropidin, Fenpropimorph, Fentinacetat, Fenthydroxyd, Ferbam, Ferimzon, Fluazinam, Flumetover, Fluoromid, Fluquinconazol, Flurprimidol, Flusilazol, Flusulfamid, Flutolanil, Flutriafol, Folpet, Fosetyl-Alminium, Fosetyl-Natrium, Fthalid, Fuberidazol, Furalaxyl, Furametpyr, Furcarbonil, Furconazol, Furconazol-cis, Furmecyclo, Fenhexamid.

15

Guazatin.

Hexachlorobenzol, Hexaconazol, Hymexazol

20

Imazalil, Imibenconazol, Iminoctadin, Iminoctadinealbesilat, Iminoctadinriacetat, Iodocarb, Ipconazol, Iprobenfos (IBP), Iprodione, Irumamycin, Isoprothiolan, Isovalledione, Iprovalicarb

25

Kasugamycin, Kresoxim-methyl, Kupfer-Zubereitungen, wie: Kupferhydroxid, Kupfernaphthenat, Kupferoxychlorid, Kupfersulfat, Kupferoxid, Oxin-Kupfer und Bordeaux-Mischung.

30

Nickel-dimethyldithiocarbamat, Nitrothal-isopropyl, Nuarimol

- Ofurace, Oxadixyl, Oxamocarb, Oxolinicacid, Oxycarboxim, Oxyfenthiin,
- 5 Paclbutrazol, Pefurazoat, Penconazol, Pencycuron, Phosdiphen, Picoxystrobin, Pimaricin, Piperalin, Polyoxin, Polyoxorim, Probenazol, Prochloraz, Procymidon, Propamocarb, Propanosine-Natrium, Propiconazol, Propineb, Pyraclostrobin, Pyrazophos, Pyrifenoxy, Pyrimethanil, Pyroquilon, Pyroxyfur,
- 10 Quinconazol, Quintozan (PCNB), Quinoxifen,
- Schwefel und Schwefel-Zubereitungen, Spiroxamine,
- 15 Tebuconazol, Tecloftalam, Tecnazen, Tetcyclacis, Tetraconazol, Thiabendazol, Thicyofen, Thifluzamide, Thiophanate-methyl, Thiram, Tioxymid, Tolclofos-methyl, Tolyfluanid, Triadimefon, Triadimenol, Triazbutil, Triazoxid, Trichlamid, Tricyclazol, Tridemorph, Trifloxystrobin, Triflumizol, Triforin, Triticonazol,
- Uniconazol,
- 20 Validamycin A, Vinclozolin, Viniconazol,
- Zarilamid, Zineb, Ziram sowie
- Dagger G,
- 25 OK-8705,
- OK-8801,
- 30 α -(1,1-Dimethylethyl)- β -(2-phenoxyethyl)-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,

- α -(2,4-Dichlorphenyl)- β -fluor- β -propyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
- α -(2,4-Dichlorphenyl)- β -methoxy- α -methyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
- 5 α -(5-Methyl-1,3-dioxan-5-yl)- β -[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methylen]-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
- (5RS,6RS)-6-Hydroxy-2,2,7,7-tetramethyl-5-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-3-octanon,
- 10 (E)- α -(Methoxyimino)-N-methyl-2-phenoxy-phenylacetamid,
- 1-(2,4-Dichlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-ethanon-O-(phenylmethyl)-oxim,
- 15 1-(2-Methyl-1-naphthalenyl)-1H-pyrrol-2,5-dion,
- 1-(3,5-Dichlorphenyl)-3-(2-propenyl)-2,5-pyrrolidindion,
- 1-[Diiodmethyl]-sulfonyl]-4-methyl-benzol,
- 20 1-[[2-(2,4-Dichlorphenyl)-1,3-dioxolan-2-yl]-methyl]-1H-imidazol,
- 1-[[2-(4-Chlorphenyl)-3-phenyloxiranyl]-methyl]-1H-1,2,4-triazol,
- 1-[1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-methoxy]-phenyl]-ethenyl]-1H-imidazol,
- 25 1-Methyl-5-nonyl-2-(phenylmethyl)-3-pyrrolidinol,
- 2',6'-Dibrom-2-methyl-4'-trifluormethoxy-4'-trifluor-methyl-1,3-thiazol-5-carboxanilid,
- 30 2,6-Dichlor-5-(methylthio)-4-pyrimidinyl-thiocyanat,

- 49 -

- 2,6-Dichlor-N-(4-trifluormethylbenzyl)-benzamid,
2,6-Dichlor-N-[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methyl]-benzamid,
5 2-(2,3,3-Triiod-2-propenyl)-2H-tetrazol,
2-[(1-Methylethyl)-sulfonyl]-5-(trichlormethyl)-1,3,4-thiadiazol,
10 2-[[6-Deoxy-4-O-(4-O-methyl- β -D-glycopyranosyl)-a-D-glucopyranosyl]-amino]-4-methoxy-1H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-5-carbonitril,
2-Aminobutan,
2-Brom-2-(brommethyl)-pentandinitril,
15 2-Chlor-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridincarboxamid,
2-Chlor-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(isothiocyanatomethyl)-acetamid,
20 2-Phenylphenol(OPP),
3,4-Dichlor-1-[4-(difluormethoxy)-phenyl]-1H-pyrrol-2,5-dion,
25 3,5-Dichlor-N-[cyan[(1-methyl-2-propynyl)-oxy]-methyl]-benzamid,
3-(1,1-Dimethylpropyl-1-oxo-1H-inden-2-carbonitril,
3-[2-(4-Chlorphenyl)-5-ethoxy-3-isoxazolidinyl]-pyridin,
30 4-Chlor-2-cyan-N,N-dimethyl-5-(4-methylphenyl)-1H-imidazol-1-sulfonamid,

- 50 -

- 4-Methyl-tetrazolo[1,5-a]quinazolin-5(4H)-on,
8-Hydroxychinolinsulfat,
5 9H-Xanthen-9-carbonsäure-2-[(phenylamino)-carbonyl]-hydrazid,
 bis-(1-Methylethyl)-3-methyl-4-[(3-methylbenzoyl)-oxy]-2,5-thiophendicarboxylat,
 cis-1-(4-Chlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-cycloheptanol,
10 cis-4-[3-[4-(1,1-Dimethylpropyl)-phenyl-2-methylpropyl]-2,6-dimethyl-morpholin-hydrochlorid,

 Ethyl-[(4-chlorphenyl)-azo]-cyanoacetat,
15 Kaliumhydrogencarbonat,

 Methantetrathiol-Natriumsalz,

20 Methyl-1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat,
 Methyl-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(5-isoxazolylcarbonyl)-DL-alaninat,
 Methyl-N-(chloracetyl)-N-(2,6-dimethylphenyl)-DL-alaninat,
25 N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-furanyl)-acetamid,
 N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-thienyl)-acetamid,

30 N-(2-Chlor-4-nitrophenyl)-4-methyl-3-nitro-benzolsulfonamid,

- N-(4-Cyclohexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,
- N-(4-Hexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,
- 5 N-(5-Chlor-2-methylphenyl)-2-methoxy-N-(2-oxo-3-oxazolidinyl)-acetamid,
- N-(6-Methoxy)-3-pyridinyl)-cyclopropancarboxamid,
- N-[2,2,2-Trichlor-1-[(chloracetyl)-amino]-ethyl]-benzamid,
- 10 N-[3-Chlor-4,5-bis-(2-propinyloxy)-phenyl]-N'-methoxy-methanimidamid,
- N-Formyl-N-hydroxy-DL-alanin -Natriumsalz,
- 15 O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat,
- O-Methyl-S-phenyl-phenylpropylphosphoramidothioat,
- S-Methyl-1,2,3-benzothiadiazol-7-carbothioat,
- 20 spiro[2H]-1-Benzopyran-2,1'(3'H)-isobenzofuran]-3'-on,
- 4-[3,4-Dimethoxyphenyl)-3-(4-fluorophenyl)-acryloyl]-morpholin
- 25 **Bakterizide:**
- Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, Nickel-dimethyldithiocarbamat, Kasugamycin, Octhilinon, Furancarbonsäure, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Tecloftalam, Kupfersulfat und andere Kupfer-Zubereitungen.
- 30

Insektizide / Akarizide / Nematizide:

- 5 Abamectin, Acephate, Acetamiprid, Acrinathrin, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb, Alpha-cypermethrin, Alphamethrin, Amitraz, Avermectin, AZ 60541, Azadirachtin, Azamethiphos, Azinphos A, Azinphos M, Azocyclotin,
- 10 Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis, Baculoviren, Beauveria bassiana, Beauveria tenella, Bendiocarb, Benfuracarb, Bensultap, Benzoximate, Betacyfluthrin, Bifenazate, Bifenthrin, Bioethanomethrin, Biopermethrin, Bistrifluron, BPMC, Bromophos A, Bufencarb, Buprofezin, Butathiofos, Butocarboxim, Butylpyridaben,
- 15 Cadusafos, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, Chloethocarb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron, Chlormephos, Chlorpyrifos, Chlorpyrifos M, Chlovaporthrin, Chromafenozide, Cis-Resmethrin, Cispermethrin, Clopythrin, Cloethocarb, Clofentezine, Clothianidine, Cyanophos, Cyclopren, Cycloprothrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyromazine,
- 20 Deltamethrin, Demeton M, Demeton S, Demeton-S-methyl, Diafenthiuron, Diazinon, Dichlorvos, Dicofol, Diflubenzuron, Dimethoat, Dimethylvinphos, Diofenolan, Disulfoton, Docusat-sodium, Dofenapyn,
- 25 Eflusilanate, Emamectin, Empenthrin, Endosulfan, Entomopthora spp., Esfenvalerate, Ethiofencarb, Ethion, Ethoprophos, Etofenprox, Etoxazole, Etrimfos, Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin oxide, Fenitrothion, Fenothiocarb, Fenoxacrim, Fenoxy carb, Fenpropathrin, Fenpyrad, Fenpyriithrin, Fenpyroximate, Fenvalerate, Fipronil, Fluazuron, Flubrocythrinate, Flucycloxuron, Flucythrinate, Flufenoxuron,
- 30 Flumethrin, Flutenzine, Fluvalinate, Fonophos, Fosmethilan, Fosthiazate, Fubfenprox, Furathiocarb,

Granuloseviren

Halofenozide, HCH, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydroprene,

5

Imidacloprid, Indoxacarb, Isazofos, Isofenphos, Isoxathion, Ivermectin,

Kernpolyederviren

10 Lambda-cyhalothrin, Lufenuron

Malathion, Mecarbam, Metaldehyd, Methamidophos, Metharhizium anisopliae,
Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methiocarb, Methoprene, Methomyl,
Methoxyfenozide, Metolcarb, Metoxadiazone, Mevinphos, Milbemectin,

15 Milbemycin, Monocrotophos,

Naled, Nitenpyram, Nithiazine, Novaluron

Omethoat, Oxamyl, Oxydemethon M

20

Paecilomyces fumosoroseus, Parathion A, Parathion M, Permethrin, Phenthroate,
Phorat, Phosalone, Phosmet, Phosphamidon, Phoxim, Pirimicarb, Pirimiphos A,
Pirimiphos M, Profenofos, Promecarb, Propargite, Propoxur, Prothiofos, Prothoat,
Pymetrozine, Pyraclofos, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridathion,
25 Pyrimidifen, Pyriproxyfen,

Quinalphos,

Ribavirin

30

Salithion, Sebufos, Silafluofen, Spinosad, Spirodiclofen, Sulfotep, Sulprofos,

Tau-fluvalinate, Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimiphos, Teflubenzuron,
Tefluthrin, Temephos, Temivinphos, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Tetradifon Theta-
cypermethrin, Thiacloprid, Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatriphos, Thiocyclam
5 hydrogen oxalate, Thiodicarb, Thiofanox, Thuringiensin, Tralocythrin, Tralomethrin,
Triarathene, Triazamate, Triazophos, Triazuron, Trichlophenidine, Trichlorfon,
Triflumuron, Trimethacarb,

Vamidothion, Vaniliprole, Verticillium lecanii

10

YI 5302

Zeta-cypermethrin, Zolaprofos

15

(1R-cis)-[5-(Phenylmethyl)-3-furanyl]-methyl-3-[(dihydro-2-oxo-3(2H)-
furanylidene)-methyl]-2,2-dimethylcyclopropanecarboxylat

(3-Phenoxyphenyl)-methyl-2,2,3,3-tetramethylcyclopropanecarboxylat

20

1-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]tetrahydro-3,5-dimethyl-N-nitro-1,3,5-triazin-2(1H)-
imin

2-(2-Chlor-6-fluorophenyl)-4-[4-(1,1-dimethylethyl)phenyl]-4,5-dihydro-oxazol

25

2-(Acetylxyo)-3-dodecyl-1,4-naphthalindion

2-Chlor-N-[[[4-(1-phenylethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid

30

2-Chlor-N-[[[4-(2,2-dichlor-1,1-disfluorethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid

3-Methylphenyl-propylcarbamat

4-[4-(4-Ethoxyphenyl)-4-methylpentyl]-1-fluor-2-phenoxy-benzol

5 4-Chlor-2-(1,1-dimethylethyl)-5-[[2-(2,6-dimethyl-4-phenoxyphenoxy)ethyl]thio]-3(2H)-pyridazinon

10 4-Chlor-2-(2-chlor-2-methylpropyl)-5-[(6-iod-3-pyridinyl)methoxy]-3(2H)-pyridazinon

15 4-Chlor-5-[(6-chlor-3-pyridinyl)methoxy]-2-(3,4-dichlorphenyl)-3(2H)-pyridazinon

Bacillus thuringiensis strain EG-2348

20 Benzoesäure [2-benzoyl-1-(1,1-dimethylethyl)-hydrazid

25 Butansäure 2,2-dimethyl-3-(2,4-dichlorphenyl)-2-oxo-1-oxaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl-ester

30 [3-[(6-Chlor-3-pyridinyl)methyl]-2-thiazolidinyliden]-cyanamid

Dihydro-2-(nitromethylen)-2H-1,3-thiazine-3(4H)-carboxaldehyd

Ethyl-[2-[[1,6-dihydro-6-oxo-1-(phenylmethyl)-4-pyridazinyl]oxy]ethyl]-carbamat

35 N-(3,4,4-Trifluor-1-oxo-3-butenyl)-glycin

N-(4-Chlorphenyl)-3-[4-(difluormethoxy)phenyl]-4,5-dihydro-4-phenyl-1H-pyrazol-1-carboxamid

40 N-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]-N'-methyl-N"-nitro-guanidin

N-Methyl-N'-(1-methyl-2-propenyl)-1,2-hydrazindicarbothioamid

N-Methyl-N'-2-propenyl-1,2-hydrazindicarbothioamid

5 O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat

N-Cyanomethyl-4-trifluormethyl-nicotinamid

10 3,5-Dichlor-1-(3,3-dichlor-2-propenyloxy)-4-[3-(5-trifluormethylpyridin-2-yloxy)-
propoxy]-benzol

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Herbiziden oder mit
Düngemitteln und Wachstumsregulatoren ist möglich.

15 Darüber hinaus weisen die erfundungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) auch
sehr gute antimykotische Wirkungen auf. Sie besitzen ein sehr breites antimykoti-
sches Wirkungsspektrum, insbesondere gegen Dermatophyten und Sproßpilze,
Schimmel und diphasische Pilze (z.B. gegen Candida-Spezies wie *Candida albicans*,
Candida glabrata) sowie *Epidermophyton floccosum*, *Aspergillus*-Spezies wie
Aspergillus niger und *Aspergillus fumigatus*, *Trichophyton*-Spezies wie *Tricho-*

20 *phyton mentagrophytes*, *Microsporon*-Spezies wie *Microsporon canis* und *audouinii*.
Die Aufzählung dieser Pilze stellt keinesfalls eine Beschränkung des erfassbaren
mykotischen Spektrums dar, sondern hat nur erläuternden Charakter.

25 Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus be-
reiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Spritz-
pulver, Pasten, lösliche Pulver, Stäubemittel und Granulate angewendet werden. Die
Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Verspritzen, Versprühen,
Verstreuen, Verstäuben, Verschäumen, Bestreichen usw. Es ist ferner möglich, die
30 Wirkstoffe nach dem Ultra-Low-Volume-Verfahren auszubringen oder die Wirkstoff-

zubereitung oder den Wirkstoff selbst in den Boden zu injizieren. Es kann auch das Saatgut der Pflanzen behandelt werden.

5 Beim Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe als Fungizide können die Aufwandmengen je nach Applikationsart innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Bei der Behandlung von Pflanzenteilen liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10 000 g/ha, vorzugsweise zwischen 10 und 1 000 g/ha. Bei der Saatgutbehandlung liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im Allgemeinen zwischen 0,001 und 50 g pro Kilogramm Saatgut, vorzugsweise zwischen 0,01 und 10 g pro Kilogramm Saatgut. Bei der Behandlung des Bodens liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10 000 g/ha, vorzugsweise zwischen 1 und 5 000 g/ha.

10

15 Wie bereits oben erwähnt, können mit erfindungsgemäßen Wirkstoffen Pflanzen und deren Teile behandelt werden. In einer bevorzugten Ausführungsform werden wild vorkommende oder durch konventionelle biologische Zuchtmethoden, wie Kreuzung oder Protoplastenfusion erhaltenen Pflanzenarten und Pflanzensorten sowie deren Teile behandelt. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform werden transgene Pflanzen und Pflanzensorten, die durch gentechnologische Methoden gegebenenfalls 20 in Kombination mit konventionellen Methoden erhalten wurden (Genetic Modified Organisms) und deren Teile behandelt. Der Begriff "Teile" bzw. "Teile von Pflanzen" oder "Pflanzenteile" wurde oben erläutert.

25 Besonders bevorzugt werden erfindungsgemäß Pflanzen der jeweils handelsüblichen oder in Gebrauch befindlichen Pflanzensorten behandelt. Unter Pflanzensorten versteht man Pflanzen mit neuen Eigenschaften ("Traits"), die sowohl durch konventionelle Züchtung, durch Mutagenese oder durch rekombinante DNA-Techniken gezüchtet worden sind. Dies können Sorten, Rassen, Bio- und Genotypen sein.

30 Je nach Pflanzenarten bzw. Pflanzensorten, deren Standort und Wachstumsbedingungen (Böden, Klima, Vegetationsperiode, Ernährung) können durch die

erfindungsgemäße Behandlung auch überadditive ("synergistische") Effekte auftreten. So sind beispielsweise erniedrigte Aufwandmengen und/oder Erweiterungen des Wirkungsspektrums und/oder eine Verstärkung der Wirkung der erfindungsgemäß verwendbaren Stoffe und Mittel, besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte möglich, die über die eigentlich zu erwartenden Effekte hinausgehen.

Zu den bevorzugten erfindungsgemäß zu behandelnden transgenen (gentechnologisch erhaltenen) Pflanzen bzw. Pflanzensorten gehören alle Pflanzen, die durch die gentechnologische Modifikation genetisches Material erhielten, welches diesen Pflanzen besondere vorteilhafte wertvolle Eigenschaften ("Traits") verleiht. Beispiele für solche Eigenschaften sind besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte. Weitere und besonders hervorgehobene Beispiele für solche Eigenschaften sind eine erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen tierische und mikrobielle Schädlinge, wie gegenüber Insekten, Milben, pflanzenpathogenen Pilzen, Bakterien und/oder Viren sowie eine erhöhte Toleranz der Pflanzen gegen bestimmte herbizide Wirkstoffe. Als Beispiele transgener Pflanzen werden die wichtigen Kulturpflanzen, wie Getreide (Weizen, Reis), Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Raps sowie Obstpflanzen (mit den Früchten Äpfel, Birnen, Zitrusfrüchten und Weintrauben) erwähnt, wobei Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle und Raps besonders hervorgehoben werden. Als Eigenschaften ("Traits") werden besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen Insekten durch in den Pflanzen entstehende Toxine, insbesondere solche, die durch das genetische Material aus

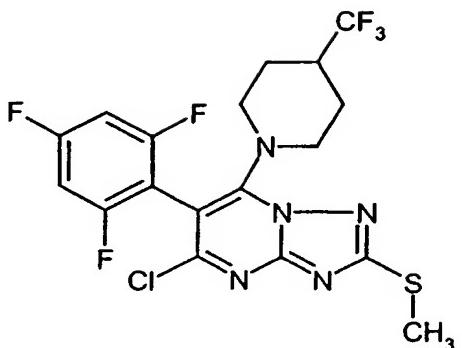
Bacillus Thuringiensis (z.B. durch die Gene CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb und CryIF sowie deren Kombinationen) in den Pflanzen erzeugt werden (im folgenden "Bt Pflanzen"). Als Eigenschaften ("Traits") werden auch besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr von Pflanzen
5 gegen Pilze, Bakterien und Viren durch Systemische Akquirierte Resistenz (SAR), Systemin, Phytoalexine, Elicitoren sowie Resistenzgene und entsprechend exprimierte Proteine und Toxine. Als Eigenschaften ("Traits") werden weiterhin besonders hervorgehoben die erhöhte Toleranz der Pflanzen gegenüber bestimmten herbiziden Wirkstoffen, beispielsweise Imidazolinonen, Sulfonylharnstoffen,
10 Glyphosate oder Phosphinotricin (z.B. "PAT"-Gen). Die jeweils die gewünschten Eigenschaften ("Traits") verleihenden Gene können auch in Kombinationen miteinander in den transgenen Pflanzen vorkommen. Als Beispiele für "Bt Pflanzen" seien Maissorten, Baumwollsorten, Sojasorten und Kartoffelsorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen YIELD GARD® (z.B. Mais, Baumwolle, Soja), KnockOut®
15 (z.B. Mais), StarLink® (z.B. Mais), Bollgard® (Baumwolle), Nucoton® (Baumwolle) und NewLeaf® (Kartoffel) vertrieben werden. Als Beispiele für Herbizid tolerante Pflanzen seien Maissorten, Baumwollsorten und Sojasorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen Roundup Ready® (Toleranz gegen Glyphosate z.B. Mais, Baumwolle, Soja), Liberty Link® (Toleranz gegen Phosphinotricin, z.B. Raps), IMI® (Toleranz gegen Imidazolinone) und STS®
20 (Toleranz gegen Sulfonylharnstoffe z.B. Mais) vertrieben werden. Als Herbizid resistente (konventionell auf Herbizid-Toleranz gezüchtete) Pflanzen seien auch die unter der Bezeichnung Clearfield® vertriebenen Sorten (z.B. Mais) erwähnt. Selbstverständlich gelten diese Aussagen auch für in der Zukunft entwickelte bzw.
25 zukünftig auf den Markt kommende Pflanzensorten mit diesen oder zukünftig entwickelten genetischen Eigenschaften ("Traits").

Die aufgeführten Pflanzen können besonders vorteilhaft mit den erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) behandelt werden. Die bei den Wirkstoffen
30 oben angegebenen Vorzugsbereiche gelten auch für die Behandlung dieser Pflanzen.

- 60 -

Besonders hervorgehoben sei die Pflanzenbehandlung mit den im vorliegenden Text speziell aufgeführten Verbindungen.

Die Erfindung wird durch die folgenden Beispiele veranschaulicht.

HerstellungsbeispieleBeispiel 1

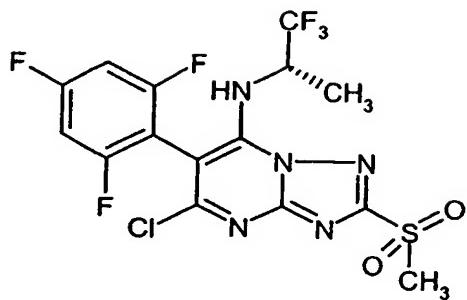
5

(1)

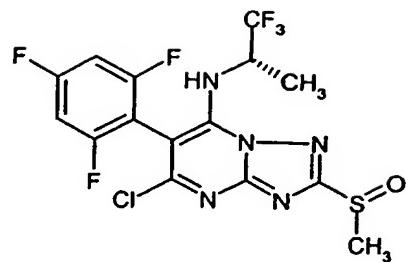
Verfahren (a)

In eine Lösung von 1 g (2,378 mMol) 5,7-Dichlor-2-(methylsulfanyl)-6-(2,4,6-trifluorphenyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin und 0,419 g (2,378 mMol) 4-Trifluormethylpiperidin in 20 ml Dichlormethan werden 0,277 g Triethylamin gegeben. Das Gemisch wird 18 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Danach wird das Reaktionsgemisch mit soviel 1N Salzsäure versetzt und gerührt, bis der pH-Wert der Mischung bei 1-2 liegt (ca. 50 ml). Die organische Phase wird abgetrennt, über Natriumsulfat getrocknet und unter verminderter Druck eingeengt. Der Rückstand wird mit Diisopropylether verrührt und abgesaugt. Man erhält 1,1 g (83,4 % der Theorie) 5-Chlor-2-(methylsulfanyl)-7-[4-(trifluormethyl)-1-piperidinyl]-6-(2,4,6-trifluorphenyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin.

HPLC: $\log P = 4,10$

Beispiel 2

(2a)



(2b)

5

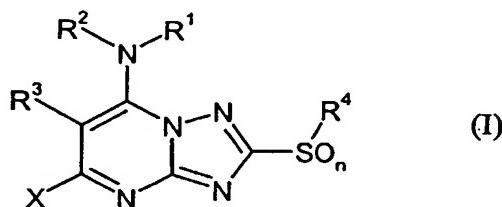
Verfahren (c)

Zu einer Lösung von 1 g (2,264 mMol) 5-Chlor-2-(methylsulfanyl)-N-[(1S)-2,2,2-trifluor-1-methylethyl]-6-(2,4,6-trifluorophenyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-amin in 20 ml Dichlormethan gibt man 0,1 g Ammoniummolybdat und 0,17 ml 98 bis 100 %ige Ameisensäure. Hierzu tropft man langsam 0,59 ml (6,8 mMol) 35 %iges Wasserstoffperoxid und röhrt 16 Stunden. Die Reaktionsmischung wird dann mit 50 ml Wasser versetzt. Danach wird die organische Phase abgetrennt, mit 50 ml 10 %iger wässriger Natriumhydrogensulfatlösung gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und unter verminderterem Druck eingeengt. Der Rückstand wird mit Diisopropylether verrührt und abgesaugt. Das Rohprodukt wird zunächst mit n-Hexan/Essigsäureethylester (1:1) und zuletzt mit reinem Essigsäureethylester an Kieselgel chromatografiert. Man erhält 260 mg (24 % der Theorie) 5-Chlor-2-(methylsulfonyl)-N-[(1S)-2,2,2-trifluor-1-methylethyl]-6-(2,4,6-trifluorophenyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-amin (2a) und 360 mg (34% der Theorie) 5-Chlor-2-(methylsulfanyl)-N-[(1S)-2,2,2-trifluor-1-methylethyl]-6-(2,4,6-trifluorophenyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-amin (2b).

2a: HPLC: logP = 2,94
 2b: HPLC: logP = 2,50

25

Nach den zuvor angegebenen Methoden werden auch die in der nachstehenden Tabelle 1 aufgeführten Verbindungen der Formel (I) erhalten.



5

Tabelle 1

Bsp. Nr.	R ¹ (***)	R ²	R ³	R ⁴	n	X	log P (**) (°C)	Fp.: (°C)
3	Cyclopentyl	-H	2-Chlorphenyl	-CH ₃	0	Cl		119-122
4	Cyclopentyl	-H	2,6-Dichlorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,17	
5	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,6-Dichlorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,9	
6	Cyclopentyl	-H	2,6-Dichlorphenyl	-CH ₃	2	Cl	3,35	
7	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,6-Dichlorphenyl	-CH ₃	2	Cl	3,73	
8	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,6-Dichlorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,82	
9	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,58	
10	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,36	
11	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,89	
12	-CH ₂ -CF ₃	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,23	
13	N-Morpholinyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,72	202-03
14	-NH-CH ₂ -CF ₃	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,07	157-59°
15	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,99	208-09
16	1-Piperidinyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,81	209-11
17	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,09	
18	-NH-CH ₂ -CF ₃	-H	2-Chlorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,1	
19	Ethylamino	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,93	215-18
20	1-Cyclopropylethylamino	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,74	
21	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-C ₂ H ₅	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,43	
22	-i-Propyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,36	
23	-NH-CH ₃	-CH ₃	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,08	213-14
24	-i-Propyl	-H	2-Chlorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,43	
25	n-Propyl	-H	2-Chlorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,4	

Bsp. Nr.	R ¹ (***))	R ²	R ³	R ⁴	n	X	logP (**)	Fp.: (°C)
26	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,53	
27	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,21	
28	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,98	
29	t-Butylamino	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,66	216-17
30	n-Butylamino	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,63	227-28
31	-NH-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,66	226-28
32	2-Hydroxyethylamino	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,14	
33	-i-Propyl	-H	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,42	
34	-CH ₂ -CH(CH ₃)-O-CH(CH ₃)- CH ₂ -	*	2-Chlorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,79	
35	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Chlorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,63	
36	-N=CH-N=CH-	*	2-Chlorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,73	
37	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Chlorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,64	
38	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,54	
39	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,34	
40	-CH ₂ -CN	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,48	
41	-i-Propyl	-H	2,6-Dichlor-3-fluor-5- trifluormethylphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,26	173-75
42	Cyclohexylmethylamino	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,41	178-81
43	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,6-Dichlor-3-fluor-5- trifluormethylphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,46	168-70
44	i-Propylamino	-H	2,6-Dichlor-3-fluor-5- trifluormethylphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,24	175-80
45	-CH ₂ -CN	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,89	
46	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,43	
47	n-Propyl	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,78	
48	Cyclopentyl	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,28	
49	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,25	
50	Cyclopropyl	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,52	
51	Cyclopropylmethyl	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,86	
52	-i-Propyl	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,81	
53	-CH ₂ -CF ₃	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,62	
54	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ -	*	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,42	
55	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,97	
56	N-Morpholinyl	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,22	
57	Dimethylamino	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,57	

Bsp. Nr.	R ¹ (***))	R ²	R ³	R ⁴	n	X	logP (**)	Fp.: (°C)
58	N-Morpholinyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	1	Cl	1,99	
59	N-Morpholinyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	2	Cl	2,37	140-42 Zer.
60	-O-CH ₃	-CH ₃	2-Chlorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,37	
61	-N=CH ₂	-CH ₃	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	2	Cl	2,61	185-88
62	2-Methoxyethyl	-C ₂ H ₅	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,61	
63	-N=CH ₂	-CH ₃	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	1	Cl	2,14	
64	-CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	1,47	
65	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,45	
66	n-Propyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,34	
67	Cyclopentyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,87	
68	2-Methoxyethyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,88	
69	Cyclopropyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,11	
70	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,66	
71	Cyclopropylmethyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,44	
72	-CH ₃	-CH ₃	2-Chlorphenyl	-CH ₃	0	Cl		
73	-C ₂ H ₅	-H	2-Chlorphenyl	-CH ₃	0	Cl		
74	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	2-Chlorphenyl	-CH ₃	0	Cl		
75	2-Methoxyethyl	-H	2-Chlorphenyl	-CH ₃	0	Cl		
76	-CH ₃	-H	2-Chlorphenyl	-CH ₃	0	Cl		
77	Cyclopropylmethyl	-H	2-Chlorphenyl	-CH ₃	0	Cl		
78	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlorphenyl	-CH ₃	0	Cl		
79	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlorphenyl	-CH ₃	0	Cl		
80	Pyrrolidin-1-yl	-H	2-Chlorphenyl	-CH ₃	0	Cl		
81	Cyclohexyl	-H	2-Chlorphenyl	-CH ₃	0	Cl		
82	1-Cyclohexylethyl	-H	2-Chlorphenyl	-CH ₃	0	Cl		
83	-CH ₂ -CF ₃	-H	2-Chlorphenyl	-CH ₃	0	Cl		
84	i-Butoxy	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	1,83	
85	-O-C ₂ H ₅	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,99	
86	4-Trifluormethylbenzyloxy	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,06	
87	-O-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,6	
88	Allyloxy	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,15	
89	t-Butoxy	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,52	
90	-O-CH ₃	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,74	
91	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	3-Chlor-4-fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,93	
92	-i-Propyl	-H	3-Chlor-4-fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,66	

Bsp. Nr.	R ¹ (***))	R ²	R ³	R ⁴	n	X	logP (**)	Fp.: (°C)
93	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,63	
94	-CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	1,47	
95	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,52	
96	-CH ₂ -CN	-H	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,47	
97	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,2	
98	n-Propyl	-H	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,37	
99	Cyclopentyl	-H	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,95	
100	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,97	
101	2-Methoxyethyl	-H	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,89	
102	Cyclopropyl	-H	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,16	
103	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,75	
104	-CH ₂ -CF ₃	-H	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,22	
105	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,22	
106	Cyclopropylmethyl	-H	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,47	
107	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-H	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,38	
108	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	-H	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,38	
109	1-Cyclohexylethyl	-H	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,97	
110	Cyclohexyl	-H	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,24	
111	2-Butyl	-H	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,74	
112	N-Morpholinyl	-H	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,73	
113	Pyrrolidin-1-yl	-H	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,58	
114	1-Cyclopropylethylamino	-H	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,76	
115	AB2	-H	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,45	
116	i-Propylamino	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,29	
117	t-Butylamino	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	2	Cl	3,44	
118	-CH ₂ -CH ₂ -CH=C(CH ₃)-CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,19	
119	-CH ₂ -CH ₂ -CH=CH-CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,78	
120	-CH ₃	-CH ₃	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,54	
121	-CH ₂ -CH(CH ₃)-O-CH(CH ₃)-CH ₂ -	*	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,15	
122	-C ₂ H ₅	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,51	
123	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -	*	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,46	
124	2-Methoxyethyl	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,4	
125	-CH ₃	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,15	
126	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ -	*	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,08	
127	n-Propylamino	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,86	

Bsp. Nr.	R ¹ (***)	R ²	R ³	R ⁴	n	X	logP (**)	Fp.: (°C)
128	AB2	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,97	
129	-NH-CH ₂ -CF ₂ -CHF ₂	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,56	
130	-NH-CH ₂ -CF ₃	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,55	
131	i-Butoxy	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,5	
132	-O-C ₂ H ₅	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,77	
133	3-Chlorbenzyloxy	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,8	
134	4-Chlorbenzyloxy	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,81	
135	4-Fluorbenzyloxy	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,47	
136	-O-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,39	
137	Allyloxy	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,93	
138	t-Butoxy	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,3	
139	-O-CH ₃	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,52	
140	-O-CH ₃	-CH ₃	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,19	
141	Benzylxy	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,68	
142	3,5-Dichlorbenzyloxy	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,43	
143	2-Chlorbenzyloxy	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,94	
144	4-Chlorbenzyloxy	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4	
145	4-Fluorbenzyloxy	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,65	
146	-n-Butoxy	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,73	
147	2,6-Dichlorbenzyloxy	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,07	
148	-O-CH ₃	-CH ₃	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,43	
149	-CH ₂ -CH(CH ₃)-O-CH(CH ₃)-CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,7	
150	-CH ₃	-CH ₃	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl		
151	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl		
152	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl		
153	n-Propyl	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl		
154	Cyclopentyl	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl		
155	-i-Propyl	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl		
156	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl		
157	2-Methoxyethyl	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl		
158	-CH ₃	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl		
159	Cyclopropyl	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl		
160	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl		
161	Cyclopropylmethyl	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl		
162	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl		

Bsp. Nr.	R ¹ (***)	R ²	R ³	R ⁴	n	X	logP (**)	Fp.: (°C)
163	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl		
164	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl		
165	1-Cyclohexylethyl	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl		
166	Cyclohexyl	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl		
167	2-Butyl	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl		
168	-NH-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	-H	2,6-Dichlor-3-fluor-5-trifluormethylphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,6	
169	i-Butoxy	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,52	
170	-O-C ₂ H ₅	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,76	
171	2-Chlorbenzyloxy	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,78	
172	3-Chlorbenzyloxy	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,83	
173	4-Chlorbenzyloxy	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,85	
174	4-Fluorbenzyloxy	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,48	
175	-O-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,42	
176	Allyloxy	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,92	
177	t-Butoxy	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,33	
178	-O-CH ₃	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,49	
179	-O-CH ₃	-CH ₃	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,09	
180	O-i-Propyl	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,05	
181	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-C ₂ H ₅	2,5-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,25	
182	-NH ₂	i-Butyl	2,6-Dichlor-3-fluor-5-trifluormethylphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,46	
183	3-Trifluormethylbenzyloxy	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,04	
184	Cyclohexyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,18	
185	-CH ₂ -CH(CH ₃)-O-CH(CH ₃)-CH ₂ -	*	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,53	
186	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,26	
187	-CH ₂ -CN	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,29	
188	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,9	
189	n-Propyl	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,15	
190	Cyclopentyl	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,69	
191	-i-Propyl	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,18	
192	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,7	
193	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,8	
194	2-Methoxyethyl	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,68	
195	Cyclopropyl	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,91	

Bsp. Nr.	R ¹ (***))	R ²	R ³	R ⁴	n	X	logP (**)	Fp.: (°C)
196	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,49	
197	-CH ₂ -CF ₃	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,01	
198	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,97	
199	Cyclopropylmethyl	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,24	
200	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,15	
201	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,18	
202	1-Cyclohexylethyl	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,7	
203	Cyclohexyl	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,97	
204	2-Butyl	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,49	
205	3-Trifluormethylcyclohexyl	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,98	
206	2-Trifluormethylcyclohexyl	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,06	
207	3,5-bis-Trifluormethylcyclohexyl	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,14	
208	4-Trifluormethylcyclohexyl	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4	
209	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,36	
210	-CH ₃	-CH ₃	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,15	
211	-C ₂ H ₅	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,03	
212	-CH ₃	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,68	
213	-CH ₂ -CH ₂ -CH=CH-CH ₂ -	*	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,89	
214	2-Hydroxypropyl	-H	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,38	
215	-NH ₂	n-Propyl	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,28	210-11
216	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-C ₂ H ₅	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,56	
217	-NH-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	-H	2,6-Dichlorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,96	213-15
219	-NH ₂	i-Butyl	4-Chlor-3-fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,91	155-7
220	-NH ₂	i-Butyl	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,58	162-64
223	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-C ₂ H ₅	2-Chlorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,57	
224	-CH ₃	-CH ₃	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,23	
225	-CH ₂ -CH(CH ₃)-O-CH(CH ₃)- CH ₂ -	*	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,84	
226	-C ₂ H ₅	-H	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,06	
227	-C(CH ₃) ₂ -CF ₃	-H	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,19	
228	-CH ₃	-H	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,71	
229	-CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,43	
230	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,61	
231	Dimethylamino	-H	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,18	
232	-NH-CH ₃	-CH ₃	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,12	
233	Ethylamino	-H	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,99	

Bsp. Nr.	R ¹ (***)	R ²	R ³	R ⁴	n	X	logP (**)	Fp.: (°C)
234	1-Ethyl-1-propylamino	-H	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,08	
235	n-Butylamino	-H	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,73	
236	-NH-CH ₂ -CF ₂ -CHF ₂	-H	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,21	
237	Allylamino	-H	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,19	
238	-NH-CH ₂ -CF ₃	-H	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,12	
239	-N(CH ₃)-COOCH ₃	-H	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,47	
240	4-Trifluormethylcyclohexyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,21	
241	2-Methoxyethyl	n-Propyl	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,03	
242	-CH ₂ -CH ₂ -NH ₂	-i- Propyl	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	1,61	
243	-CH ₂ -CH(OH)-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,38	
244	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,88	
245	-CH ₂ -CH(NH ₂)-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	1,51	
246	AB8	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,22	
247	AB9	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	1,56	
248	-CH ₂ -CH ₂ -CH(OH)-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,5	
249	AB10	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,43	
250	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,45	
251	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,51	
252	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,51	
253	-CH ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,78	
254	AB11	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	1,68	
255	-CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₃) ₂	-CH ₃	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	1,64	
256	3-(Dimethylamino)-propyl	-CH ₃	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	1,74	
257	-CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₃) ₂	-C ₂ H ₅	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	1,82	
258	-CH ₂ CH ₂ OH	-C ₂ H ₅	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,32	
259	-CH ₂ -CH ₂ -NH ₂	-C ₂ H ₅	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	1,54	
260	-CH ₂ -CH ₂ -NH ₂	n-Propyl	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	1,66	
261	3-Aminopropyl	n-Propyl	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	1,72	
262	Benzylxy	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,49	
263	3,5-Dichlorbenzylxy	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,33	
264	4-Trifluormethylbenzylxy	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,97	
265	2-Chlorbenzylxy	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,77	
266	3-Trifluormethylbenzylxy	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,94	
267	-n-Butoxy	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,53	
268	2,6-Dichlorbenzylxy	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,92	

- 71 -

Bsp. Nr.	R ¹ (***))	R ²	R ³	R ⁴	n	X	logP (**)	F.p.: (°C)
269	Benzylxy	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,49	
270	3,5-Dichlorbenzylxy	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,37	
271	-O-n-Propyl	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,35	
272	4-Trifluormethylbenzylxy	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,02	
273	3-Trifluormethylbenzylxy	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,99	
274	-n-Butoxy	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,57	
275	2-Hexahydropyranloxy	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,2	
276	2,6-Dichlorbenzylxy	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,03	
277	i-Butyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,66	
278	n-Butyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,71	
279	-CH ₂ -C(CH ₃) ₃	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,06	
280	Propargyl	-CH ₃	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,28	
281	1,3-Dioxolan-2-ylmethyl	-CH ₃	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,23	
282	Allyl	-CH ₃	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,76	
283	-CH ₂ -CH ₂ -CN	-CH ₃	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,83	
284	-CH ₂ -CH(OCH ₃) ₂	-CH ₃	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,36	
285	(2-Furyl)methyl	-CH ₃	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,77	
286	i-Butyl	-CH ₃	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,25	
287	2-Methoxyethyl	-CH ₃	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,27	
288	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-CH ₃	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,11	
289	n-Butyl	-CH ₃	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,31	
290	i-Butyl	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,09	
291	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,74	
292	Cyclohexyl	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,59	
293	1-Cyclohexylethyl	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	5,23	
294	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,78	
295	4-Trifluormethylcyclohexyl	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,53	
296	-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,76	
297	-CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₃) ₂	-CH ₃	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	1,82	
298	1,3-Dioxolan-2-ylmethyl	-CH ₃	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,64	
299	-CH ₂ -CH ₂ -CN	-CH ₃	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,19	
300	-CH ₂ -CH(OCH ₃) ₂	-CH ₃	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,78	
301	(2-Furyl)methyl	-CH ₃	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,11	
302	i-Butyl	-CH ₃	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,58	
303	2-Methoxyethyl	-CH ₃	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,69	
304	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-CH ₃	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,43	

Bsp. Nr.	R ¹ (***)	R ²	R ³	R ⁴	n	X	logP (**)	Fp.: (°C)
305	-CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₃) ₂	-C ₂ H ₅	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	1,97	
306	(2-Tetrahydrofuryl)methyl	-C ₂ H ₅	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,31	
307	2-Methoxyethyl	-C ₂ H ₅	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,05	
308	-CH ₂ -CH(CH ₃)-O-CH(CH ₃)- CH ₂ -	*	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,5	
309	-C ₂ H ₅	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,83	
310	-CH ₂ -CN	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,27	
311	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,78	
312	-C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -COCH ₃	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,2	
313	-C ₂ H ₅	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,86	
314	-C(CH ₃) ₂ -CF ₃	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,05	
315	-CH ₃	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,53	
316	-CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,05	
317	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,27	
318	-CH ₃	-CH ₃	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3	
319	i-Butoxy	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,17	
320	-O-C ₂ H ₅	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,43	
321	Benzylxy	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,11	
322	3,5-Dichlorbenzylxy	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,75	
323	2,4-Dichlorbenzylxy	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,73	
324	4-Trifluormethylbenzylxy	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,41	
325	2-Chlorbenzylxy	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,3	
326	3-Chlorbenzylxy	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,33	
327	4-Chlorbenzylxy	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,31	
328	4-Fluorbenzylxy	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,04	
329	-O-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,06	
330	3-Trifluormethylbenzylxy	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,37	
331	-n-Butoxy	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,39	
332	Allyloxy	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,59	
333	t-Butoxy	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,98	
334	2-Hexahydropyranloxy	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,82	
335	2,6-Dichlorbenzylxy	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,23	
336	-O-CH ₃	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,15	
337	-O-CH ₃	-CH ₃	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,85	
338	O-i-Propyl	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,71	
339	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,52	

Bsp. Nr.	R ¹ (***)	R ²	R ³	R ⁴	n	X	logP (**)	Fp.: (°C)
340	1-Cyclopropylethyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,71	
341	i-Butyl	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,46	
342	n-Butyl	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,5	
343	-CH ₂ -C(CH ₃) ₃	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,88	
344	-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,19	
345	Propargyl	-CH ₃	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,1	
346	Allyl	-CH ₃	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,59	
347	-CH ₂ -CH ₂ -CN	-CH ₃	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,66	
348	-CH ₂ -CH(OCH ₃) ₂	-CH ₃	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,16	
349	(2-Furyl)methyl	-CH ₃	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,58	
350	i-Butyl	-CH ₃	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,06	
351	2-Methoxyethyl	-CH ₃	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,08	
352	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-CH ₃	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,94	
353	n-Butyl	-CH ₃	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,13	
354	-CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₃) ₂	-C ₂ H ₅	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	1,66	
355	Allyl	-C ₂ H ₅	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,91	
356	(2-Furyl)methyl	-C ₂ H ₅	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,89	
357	(2-Tetrahydrofuryl)methyl	-C ₂ H ₅	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,67	
358	-CH ₂ -CH ₂ -CN	-C ₂ H ₅	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,93	
359	2-Methoxyethyl	-C ₂ H ₅	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,4	
360	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,38	
361	n-Butyl	-C ₂ H ₅	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,47	
362	-CH ₂ CH ₂ OH	n-Propyl	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,65	
363	3-Aminopropyl	n-Propyl	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	1,55	
364	Cyclopropylmethyl	n-Propyl	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,49	
365	(2-Tetrahydropyranyl)methyl	n-Propyl	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,64	
366	(2-Tetrahydrofuryl)methyl	n-Propyl	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,06	
367	2,2-Diethoxy-ethyl	n-Butyl	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	5,03	
368	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,5-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,43	
369	-O-CH ₃	-H	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,66	
370	n-Butyl	-C ₂ H ₅	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,98	
371	Cyclopropylmethyl	n-Propyl	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	5,01	
372	(2-Tetrahydropyranyl)methyl	n-Propyl	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	5,29	
373	(2-Tetrahydrofuryl)methyl	n-Propyl	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,72	
374	2-Methoxyethyl	n-Propyl	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,42	
375	-CH ₂ -CH(OH)-CH ₂ -CH ₂ -	*	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,72	

Bsp. Nr.	R ¹ (***))	R ²	R ³	R ⁴	n	X	logP (**)	Fp.: (°C)
376	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-	*	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,21	
377	AB8	*	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,56	
378	AB9	*	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	1,79	
379	-CH ₂ -CH ₂ -CH(OH)-CH ₂ -CH ₂ -	*	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,84	
380	n-Butyl	-H	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,62	
381	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	-CH ₃	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,31	
382	-CH ₂ -CN	-CH ₃	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,85	
383	-CH ₂ -COOCH ₃	-CH ₃	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,98	
384	-CH ₂ -CH ₂ -Cl	-CH ₃	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,61	
385	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH=CH ₂	-CH ₃	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,45	
386	2-Butyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,74	
387	-CH=C(CH ₃) ₂	-C ₂ H ₅	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,18	
388	Allyl	-C ₂ H ₅	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,14	
389	(2-Furyl)methyl	-C ₂ H ₅	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,14	
390	(2-Tetrahydrofuryl)methyl	-C ₂ H ₅	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,93	
391	-CH ₂ -CH ₂ -CN	-C ₂ H ₅	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,15	
392	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,65	
393	n-Butyl	-C ₂ H ₅	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,7	
394	-CH ₂ CH ₂ OH	n-Propyl	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,96	
395	Cyclopropylmethyl	n-Propyl	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,73	
396	(2-Tetrahydropyranyl)methyl	n-Propyl	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,91	
397	-CH ₂ -CH ₂ -COOC ₂ H ₅	n-Propyl	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,47	
398	(2-Tetrahydrofuryl)methyl	n-Propyl	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,34	
399	2-Thienylmethyl	n-Propyl	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,76	
400	-C(CH ₃) ₂ -CF ₃	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,07	
401	1-Cyclohexylethyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,93	
402	3-Trifluormethylcyclohexyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,21	
403	2-Trifluormethylcyclohexyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,31	
404	-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,43	
405	3,5-bis-Trifluormethylcyclohexyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,37	
406	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	Cyclo- propyl	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,76	
407	-CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,07	
408	-CH ₂ -CH ₂ -CO-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,84	
409	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -CH(CH ₃)- CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,87	

Bsp. Nr.	R ¹ (***)	R ²	R ³	R ⁴	n	X	logP (**) (°C)	Fp.: (°C)
410	-CH ₂ -CH(OH)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,74	
411	-CH ₂ -CH ₂ -CH(COCH ₃)-CH ₂ - CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,2	
412	-CH ₂ -CH=C(C ₂ H ₅)-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,85	
413	-CH(CH ₂ -NH ₂)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,68	
414	-CH ₂ -CH ₂ -CH(COOCH ₃)-CH ₂ - CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,94	
415	-CH ₂ -CH ₂ -CHBr-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,51	
416	-CH(COOCH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,16	
417	-CH ₂ -CH ₂ -CHF-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,61	
418	AB12	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,98	
419	-CH ₂ -CH ₂ -CH(NH-COCH ₃)- CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,44	
420	-CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,42	
421	AB14	*	2,4,6-Trifluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,36	
422	3-Aminopropyl	n-Propyl	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	1,93	
423	2-Thienylmethyl	n-Propyl	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	5,05	
424	-CH ₂ -CH ₂ -NH ₂	-i- Propyl	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	1,83	
425	-CH ₂ -CH ₂ -CN	-i- Propyl	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,82	
426	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	Cyclo- propyl	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,13	
427	-CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,39	
428	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,86	
429	n-Butyl	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,19	
430	-CH ₂ -C(CH ₃) ₃	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,5	
431	2-Butyl	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,16	
432	3,5-bis-Trifluormethylcyclohexyl	-H	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,69	
433	Propargyl	-CH ₃	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,71	
434	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	-CH ₃	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,73	
435	Allyl	-CH ₃	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,15	
436	-CH ₂ -CN	-CH ₃	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,23	
437	-CH ₂ -CH ₂ -Cl	-CH ₃	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,92	

Bsp. Nr.	R ¹ (***)	R ²	R ³	R ⁴	n	X	log P (**)	Fp.: (°C)
438	-CH=C(CH ₃) ₂	-C ₂ H ₅	Pentafluorophenyl	-CH ₃	0	Cl	2,5	
439	Allyl	-C ₂ H ₅	Pentafluorophenyl	-CH ₃	0	Cl	4,46	
440	(2-Furyl)methyl	-C ₂ H ₅	Pentafluorophenyl	-CH ₃	0	Cl	4,48	
441	-CH ₂ -CH ₂ -CN	-C ₂ H ₅	Pentafluorophenyl	-CH ₃	0	Cl	3,5	
442	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	Pentafluorophenyl	-CH ₃	0	Cl	4,07	
443	-NH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4,6-Trifluorophenyl	-CH ₃	0	Cl	3,45	175-7
444	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -	*	2-Chlorophenyl	-CH ₃	0	Cl	4,69	
445	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	0	Cl	3,44	
446	-CH ₂ -COOCH ₃	-CH ₃	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	0	Cl	2,8	
447	1,3-Dioxolan-2-ylmethyl	-CH ₃	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	0	Cl	3,1	
448	-CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₃) ₂	-CH ₃	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	0	Cl	1,43	
449	3-(Dimethylamino)-propyl	-CH ₃	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	0	Cl	2,81	
450	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	-CH ₃	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	0	Cl	3,14	
451	-CH ₂ -CH ₂ -Cl	-CH ₃	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	0	Cl	3,44	
452	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-C ₂ H ₅	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	0	Cl	4,27	
453	2-Methoxyethyl	n-Propyl	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	0	Cl	3,78	
454	-CH ₂ -CH ₂ -NH ₂	i- Propyl	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	0	Cl	1,47	
455	-CH ₂ -CH(OH)-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	0	Cl	2,17	
456	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-	*	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	0	Cl	3,63	
457	AB8	*	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	0	Cl	2,03	
458	-CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	0	Cl	3,78	
459	AB9	*	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	0	Cl	1,42	
460	-CH ₂ -CH ₂ -CH=CH-CH ₂ -	*	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	0	Cl	3,6	
461	AB10	*	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	0	Cl	3,19	
462	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -CH(CH ₃)- CH ₂ -	*	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	0	Cl	4,69	
463	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-	*	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	0	Cl	4,2	
464	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -	*	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	0	Cl	4,2	
465	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	0	Cl	4,27	
466	-CH ₂ -CH(OH)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	0	Cl	2,49	
467	-CH ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	0	Cl	4,52	
468	-CH ₂ -CH ₂ -CH(COCH ₃)-CH ₂ - CH ₂ -	*	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	0	Cl	2,92	
469	-CH ₂ -CH=C(C ₂ H ₅)-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,6-Difluorophenyl	-CH ₃	0	Cl	4,44	

Bsp. Nr.	R ¹ (***)	R ²	R ³	R ⁴	n	X	logP (**)	Fp.: (°C)
470	-CH ₂ -CH ₂ -CH=C(CH ₃)-CH ₂ -	*	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,02	
471	-CH(CH ₂ Cl)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ - CH(CHCl)-	*	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,23	
472	-CH ₂ -CH ₂ -CH(COOCH ₃)-CH ₂ - CH ₂ -	*	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,25	
473	-CH ₂ -CH ₂ -CHBr-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,91	
474	-CH(COOCH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -	*	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,56	
475	AB12	*	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,71	
476	-CH ₂ -CH ₂ -CH(NH-COCH ₃)- CH ₂ -CH ₂ -	*	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,18	
477	-CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	1,4	
478	AB14	*	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,13	
479	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-	*	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,75	
480	AB9	*	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	1,47	
481	-CH ₂ -CH ₂ -CH(OH)-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,32	
482	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-	*	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,26	
483	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,38	
484	-CH ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,6	
485	-CH ₂ -CH ₂ -CH(COCH ₃)-CH ₂ - CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,02	
486	-CH ₂ -CH=C(C ₂ H ₅)-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,45	
487	-CH ₂ -CH ₂ -CH=C(CH ₃)-CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,09	
488	-CH ₂ -CH ₂ -CH(COOCH ₃)-CH ₂ - CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,32	
489	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,99	
490	-CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	1,42	
491	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,97	
492	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,53	
493	-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	-H	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,19	
494	-CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,12	
495	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,45	
496	-CH ₂ -CH ₂ -CH=CH-CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,77	
497	AB10	*	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,33	
498	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -CH(CH ₃)- CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,88	

Bsp. Nr.	R ¹ (***)	R ²	R ³	R ⁴	n	X	logP (**)	Fp.: (°C)
499	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,46	
500	-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ - CH(CH ₃)-	*	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,37	
501	-CH ₂ -CH(OH)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,65	
502	-CH ₂ -CH ₂ -CHF-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,51	
503	-CH ₂ -CH(CH ₃)-O-CH(CH ₃)- CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,63	
504	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,93	
505	i-Butyl	-H	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,67	
506	-CH ₂ -C(CH ₃) ₃	-H	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,07	
507	2-Butyl	-H	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,69	
508	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	-H	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,33	
509	Cyclopentyl	-H	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,88	
510	-i-Propyl	-H	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,36	
511	Cyclohexyl	-H	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,16	
512	1-Cyclohexylethyl	-H	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,9	
513	Cyclopropyl	-H	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,1	
514	-CH ₂ -CF ₃	-H	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,19	
515	Cyclopropylmethyl	-H	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,42	
516	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-H	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,34	
517	3-Trifluormethylcyclohexyl	-H	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,14	
518	2-Trifluormethylcyclohexyl	-H	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,18	
519	4-Trifluormethylcyclohexyl	-H	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,11	
520	-CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₃) ₂	-CH ₃	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	1,58	
521	Propargyl	-CH ₃	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,29	
522	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	-CH ₃	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,32	
523	1,3-Dioxolan-2-ylmethyl	-CH ₃	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,23	
524	Allyl	-CH ₃	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,75	
525	-CH ₂ -CH ₂ -CN	-CH ₃	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,84	
526	-CH ₂ -CN	-CH ₃	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,84	
527	(2-Furyl)methyl	-CH ₃	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,78	
528	i-Butyl	-CH ₃	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,27	
529	-CH ₂ -CH ₂ -Cl	-CH ₃	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,56	
530	2-Methoxyethyl	-CH ₃	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,27	
531	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-CH ₃	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,12	
532	-CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₃) ₂	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	1,71	

Bsp. Nr.	R ¹ (***)	R ²	R ³	R ⁴	n	X	log P (**)	Fp.: (°C)
533	Allyl	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,09	
534	(2-Tetrahydrofuryl)methyl	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,95	
535	-CH ₂ -CH ₂ -CN	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,12	
536	2-Methoxyethyl	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,57	
537	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,62	
538	Cyclopropylmethyl	n-Propyl	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,65	
539	(2-Tetrahydrofuryl)methyl	n-Propyl	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,32	
540	2-Methoxyethyl	n-Propyl	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,99	
541	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	Cyclo- propyl	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,87	
542	-CH ₂ -CH(OH)-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,4-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,33	
543	1,2-Dimethylpropyl	-H	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,83	
544	1,2-Dimethylpropyl	-H	2-Fluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,83	
545	2-Thienylmethyl	n-Propyl	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,61	
546	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	Cyclo- propyl	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,58	
547	-CH ₂ -CH(NH ₂)-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	1,39	
548	-CH ₂ -CH ₂ -CHF-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,45	
549	-CH ₂ -CH ₂ -CO-CH ₂ -CH ₂ -	*	2,6-Difluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,68	
550	-CH ₂ -CH ₂ -CH=CH-CH ₂ -	*	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,2	
551	AB10	*	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,86	
552	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -CH(CH ₃)- CH ₂ -	*	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	5,31	
553	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-	*	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,83	
554	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -	*	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,89	
555	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -	*	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,88	
556	-CH ₂ -CH(OH)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,14	
557	-CH ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	5,13	
558	-CH ₂ -CH ₂ -CH(COCH ₃)-CH ₂ - CH ₂ -	*	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,6	
559	-CH ₂ -CH=C(C ₂ H ₅)-CH ₂ -CH ₂ -	*	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	5	
560	-CH ₂ -CH ₂ -CH=C(CH ₃)-CH ₂ -	*	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,6	
561	-CH ₂ -CH ₂ -CH(COOCH ₃)-CH ₂ - CH ₂ -	*	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	3,89	
562	-CH ₂ -CH ₂ -CHBr-CH ₂ -CH ₂ -	*	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,5	
563	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	*	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,12	

Bsp. Nr.	R ¹ (***))	R ²	R ³	R ⁴	n	X	logP (**))	Fp.: (°C)
564	AB12	*	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,36	
565	AB11	*	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	1,91	
566	-CH ₂ -CH ₂ -CH(NH-COCH ₃)- CH ₂ -CH ₂ -	*	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	2,79	
567	AB14	*	Pentafluorphenyl	-CH ₃	0	Cl	4,67	

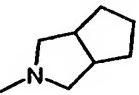
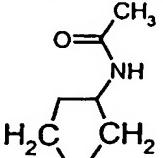
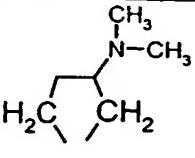
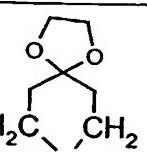
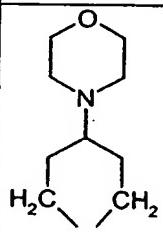
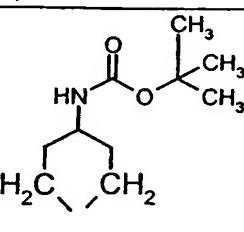
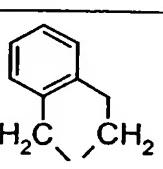
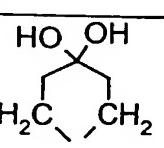
** Die Bestimmung der logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V. A8 durch HPLC (Gradientenmethode, Acetonitril/0,1 % wässrige Phosphorsäure)

5

* R¹ und R² bilden gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen heterocyclischen Ring.

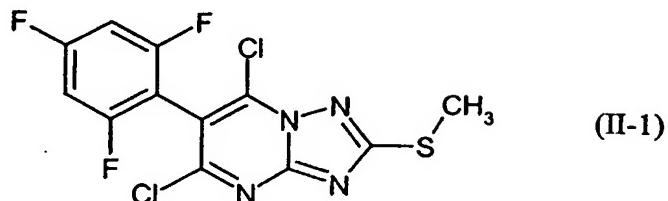
10

*** Die Abkürzungen AB2, AB8, AB9 AB10, AB11, AB12, AB14 und AB29 haben die folgenden Bedeutungen:

AB2	AB8	AB9	AB10
			
AB11	AB12	AB14	AB29
			

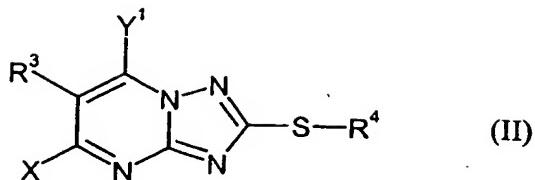
Herstellung von AusgangsstoffenBeispiel 568

5



31,3 g (95,35 mMol) 2-Methylsulfanyl-6-(2,4,6-trifluorophenyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-5,7-diol werden bei Raumtemperatur in 140 ml Phosphoroxychlorid gelöst, portionsweise mit 14,1 g Phosphorpentachlorid versetzt und anschließend 10 16 Stunden unter Rückfluss erhitzt. Flüchtige Bestandteile der Reaktionsmischung unter verminderterem Druck abdestilliert. Der Rückstand wird mit 200 ml Wasser versetzt und mit 100 ml Dichlormethan extrahiert. Die organische Phase wird über Natriumsulfat getrocknet und an Kieselgel zunächst mit Essigsäureethylester/n-Hexan (1:3) und zuletzt mit reinem Essigsäureethylester chromatografiert. Man erhält 18 g (50 % der Theorie) 5,7-Dichlor-2-(methylsulfanyl)-6-(2,4,6-trifluorophenyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin.
15 HPLC: logP = 3,43

Nach der zuvor angegebenen Methode werden auch die in der folgenden Tabelle 2
20 aufgeführten Dihalogen-triazolopyrimidine der Formel (II) erhalten.

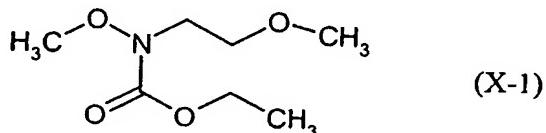
Tabelle 2

Bsp.Nr.	Verb.	R ³	R ⁴	X	Y ¹	logP	Fp. (°C)
569	II-2	2-Chlorphenyl	-CH ₃	-Cl	-Cl		159-164
570	II-3	2-Chlorphenyl	-i-Propyl	-Cl	-Cl		
571	II-4	2-Chlorphenyl	4-Chlorbenzyl	-Cl	-Cl		
572	II-5	2,6-Dichlorphenyl	-CH ₃	-Cl	-Cl	3,86	

5

Beispiel 573

Verfahren (f), erste Stufe



10

1000 mg N-Methoxy-carbaminsäureethylester werden in 10,0 ml Dimethylformamid vorgelegt und portionsweise mit 403 mg Natriumhydrid versetzt, wobei die Temperatur durch Kühlung auf 30°C eingestellt wurde. Die Reaktionsmischung wird für 2 Stunden bei 30°C gerührt und anschließend mit 3500 mg 2-Bromethyl-methylether versetzt. Die Reaktionsmischung wird für 18 Stunden bei 20°C bis 25°C gerührt und anschließend in 20 ml Wasser eingerührt. Die erhaltene Reaktionsmischung wird unter verminderter Druck zur Trockne eingeengt und viermal mit je 30 ml Dichlormethan extrahiert. Die organische Extrakte werden über Natriumsulfat getrocknet, filtriert und unter verminderter Druck zu Trockne eingeengt.

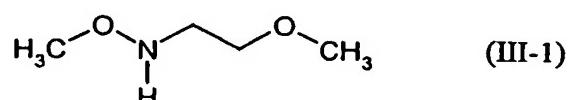
15

20

Man erhält 1200 mg (N-Methoxy-N-methoxyethylcarbaminsäure-ethylester (Reinheit 77,6 %, Ausbeute 62,6 %).

Verfahren (f), zweite Stufe:

5



200 mg (N-Methoxy-N-methoxyethyl)-carbaminsäureethylester werden in 4,0 ml wässrigem Ethanol (59 %ig) vorgelegt, mit 240,6 mg Kaliumhydroxid versetzt und für 18 Stunden bei 40°C gerührt. Die Reaktionsmischung wird dann in 50 ml Wasser eingerührt, dreimal mit je 20 ml Diethylether und dreimal mit je 20 ml Dichlormethan extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden zweimal mit je 20 ml Wasser gewaschen, getrocknet und bei 20°C unter verminderter Druck auf ein Volumen von 20 ml eingeeengt.

Die erhaltene Lösung wird unter Eiskühlung mit 2 ml Salzsäure versetzt, 1 Stunde bei Raumtemperatur gerührt und bei 20°C unter verminderter Druck zur Trockne eingeengt.

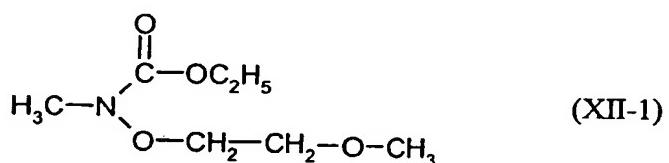
5

Man erhält 140 mg N-Methoxy-N-methoxyethylamin-hydrochlorid (Ausbeute 87,6 %).

Beispiel 574

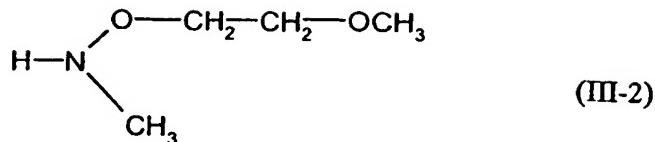
10

Verfahren (g), erste Stufe:



- 15 Ein Gemisch aus 1000 mg N-Hydroxy-N-methyl-carbaminsäure-ethylester, 1166 mg 2-Bromethyl-methylether und 10 ml Ethanol wird unter Röhren auf Rückflusstemperatur erhitzt und dann tropfenweise mit einer Lösung von 493 mg Kaliumhydroxid in 5 ml Ethanol versetzt. Man kocht das Reaktionsgemisch 10 Stunden unter Rückfluss und arbeitet dann auf, indem man das Reaktionsgemisch filtriert und das Filtrat unter verminderter Druck einengt. Der verbleibende Rückstand wird mit einem Gemisch aus Wasser und Essigsäureethylester versetzt. Die organische Phase wird abgetrennt, mit gesättigter, wässriger Ammoniumchlorid-Lösung und dann mit Wasser gewaschen. Anschließend wird die organische Phase über Natriumsulfat getrocknet und unter verminderter Druck eingeengt. Man erhält auf diese Weise 0,7 g eines Produktes, das gemäß Gaschromatogramm zu 83 % aus (N-Methyl-N-methoxyethoxy)-carbaminsäure-ethylester besteht. Die Ausbeute errechnet sich danach zu 39 % der Theorie.
- 20
- 25

Verfahren (g), zweite Stufe:

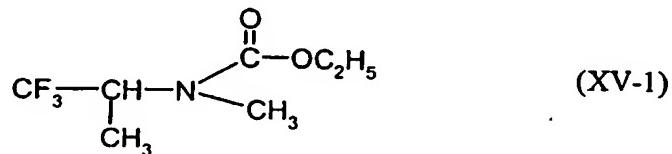


- 5 Ein Gemisch aus 200 mg (N-Methyl-N-methoxyethoxy)-carbaminsäure-ethylester, 4 ml Ethanol und 4 ml Wasser wird mit 240,6 mg pulverisiertem Kaliumhydroxid versetzt und 42 Stunden bei 40°C gerührt. Das Reaktionsgemisch wird danach in 50 ml Wasser eingerührt, dann dreimal mit je 20 ml Diethylether und anschließend dreimal mit je 20 ml Methylenchlorid extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden zweimal mit je 20 ml Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und bei Raumtemperatur unter verminderter Druck auf ein Volumen von 20 ml eingeengt. Die erhaltene Lösung wird unter Eiskühlung mit 1 ml etherischer Salzsäure versetzt. Die sich abscheidenden Kristalle werden abfiltriert und getrocknet. Man erhält auf diese Weise 190 mg an N-Methyl-N-methoxyethoxy-amin-hydrochlorid.
- 10
- 15

Beispiel 575

Verfahren (h), erste Stufe:

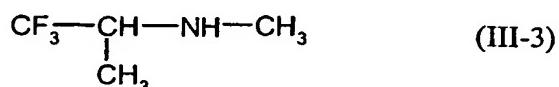
20



- Ein Gemisch aus 2000 mg N-(2,2,2-Trifluor-1-methyl-ethy!)-carbaminsäure-ethylester und 20 ml Tetrahydrofuran wird bei Raumtemperatur unter Rühren mit 475 mg Natriumhydroxid versetzt. Danach wird unter Rühren bei Raumtemperatur eine Lösung von 4600 mg Iodmethan in 10 ml Tetrahydrofuran hinzugeropft. Das
- 25

Reaktionsgemisch wird 16 Stunden bei 50°C gerührt und dann mit Wasser versetzt. Man extrahiert dreimal mit je 20 ml Methylenechlorid, trocknet die vereinigten organischen Phasen über Natriumsulfat und engt unter verminderterem Druck ein. Man erhält 1000 mg eines Produktes, das gemäß Gaschromatogramm zu 75 % aus N-(2,2,2-Trifluor-1-methyl-ethyl)-N-methyl-carbaminsäure-ethylester besteht. Die Ausbeute errechnet sich danach zu 34.86 %.

Verfahren (h), zweite Stufe:



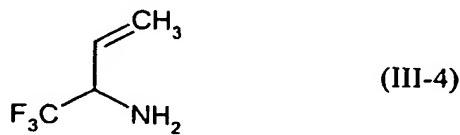
10

Ein Gemisch aus 1000 mg N-(2,2,2-Trifluor-1-methyl-ethyl)-N-methylcarbaminsäure-ethylester, 20 ml Ethanol und 20 ml Wasser wird mit 1070 mg pulverisierten Kaliumhydroxid versetzt und 66 Stunden bei 40°C gerührt. Danach wird das Reaktionsgemisch mit Wasser verdünnt und dreimal mit je 20 ml eines Gemisches extrahiert, das zu gleichen Teilen aus Methylenechlorid und Diethylether besteht. Die vereinigten organischen Phasen werden über Natriumsulfat getrocknet und dann bei Raumtemperatur unter leicht verminderterem Druck eingeengt. Die erhaltene Lösung wird unter Eiskühlung mit etherischer Salzsäure versetzt und 60 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Nach dem Einengen unter verminderterem Druck erhält man 280 mg an N-(2,2,2-Trifluor-1-methyl-ethyl)-N-methylaminhydrochlorid. Die Ausbeute errechnet sich danach zu 34 % der Theorie.

Beispiel 576

25

Verfahren (i):



WO 02/088127

PCT/EP02/04441

- 88 -

600 mg N-(1-Trifluormethyl-2-propen)-carbaminsäurebenzylester werden in 8,0 ml 16 %iger Salzsäure für 1,5 Stunden unter Rückfluss erhitzt. Nach dem Abkühlen auf 20°C wird zweimal mit je 20 ml Diethylether extrahiert.

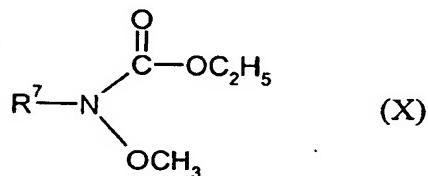
- 5 Die verbleibende wässrige Phase wird unter verminderter Druck zur Trockne eingeengt und dreimal mit je 10 ml Methanol versetzt. Nach Entfernen des Methanols unter verminderter Druck werden 310 mg an (1-Trifluormethyl-prop-2-en)-amin-hydrochlorid isoliert. Die Ausbeute errechnet sich danach zu 82,9 % der Theorie.

10

Nach dem zuvor angegebenen Methoden lassen sich auch die in den folgenden Tabellen angegebenen Carbamate herstellen.

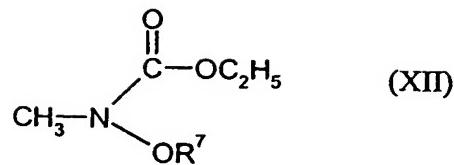
Tabelle 3

15



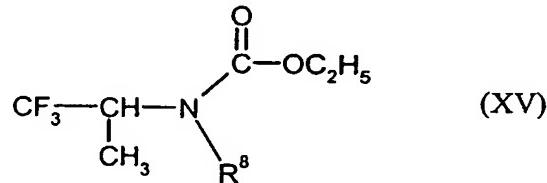
Beispiel-Nr.	Verb.-Nr.	R ⁷	logP
577	X-2	$\begin{array}{c} \text{CH}_3-\text{CH}-\text{CH}_2- \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	2,38
578	X-3	$\begin{array}{c} \text{CH}_2=\text{C}-\text{CH}_2- \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	2,06

- 90 -

Tabelle 4

Beispiel-Nr.	Verb.-Nr.	R⁷	Physikalische Konst.
579	XII-22	$\text{CH}_2-\underset{\text{CH}_3}{\text{C}}-\text{CH}_2-$	

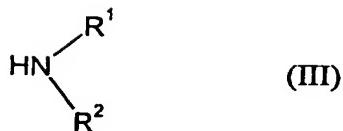
5

Tabelle 5

Beispiel-Nr.	Verb.-Nr.	R⁸	Physikalische Konst.
580	XV-2	-C ₂ H ₅	¹ H-NMR (400 MHz, CD ₃ CN): δ (ppm) = 1,13 (t, CH ₃ CH ₂ N), 1,21 (t, CH ₃ CHCF ₃), 1,23 (t, CH ₃ CH ₂ O), 3,20 (m, CH ₂ N, CHCF ₃), 4,1 (q, CH ₃ CH ₂ O).

10

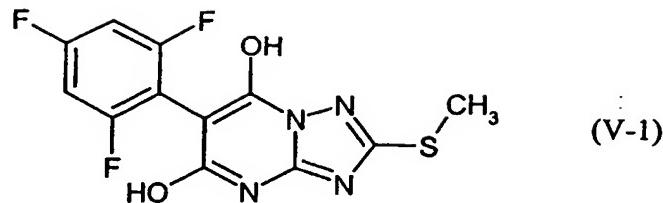
Nach den zuvor angegebenen Methoden lassen sich auch die in der folgenden Tabelle aufgeführten Amine herstellen.

Tabelle 6

Bsp.-Nr.	Verb.-Nr.	R ¹	R ²	Physikal. Konst.
581	III-5	$\begin{array}{c} \text{CH}_3-\text{CH}-\text{CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	-OCH ₃	¹ H-NMR (400 MHz, CD ₃ CN): δ (ppm) = 1,03 (d, (CH ₃) ₂ CH), 3,06 (d, CH ₂), 3,28 (b, (CH ₃) ₂ CH), 4,01 (s, OCH ₃)
582	III-6	$\begin{array}{c} \text{CH}_2-\text{C}-\text{CH}_2 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	-OCH ₃	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO): δ (ppm) = 1,76 (s, CH ₃ -(CCH ₂)CH ₂), 3,29 (b, NH, CH ₃ (CCH ₂)CH ₂ , OCH ₃), 7,89, 5,02 (2 s, CH ₃ (CCH ₂)CH ₂).
583	III-7	$\begin{array}{c} \text{CH}_2-\text{C}-\text{CH}_2 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	-CH ₃	
584	III-8	$\begin{array}{c} \text{CF}_3-\text{CH}- \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	-C ₂ H ₅	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO): δ (ppm) = 1,06 (m, CH ₃ CH ₂ N, CH ₃ CHCF ₃), 3,20 (m, CH ₂ N), 4,1 (m, CHCF ₃)

5

Die in den Beispielen 581-584 aufgeführten Amine wurden jeweils in Form ihrer Hydrochloride isoliert und charakterisiert.

Beispiel 585

5 5 g (19,1 mMol) 2-(2,4,6-trifluor-phenyl)malonsäuredimethylester und 2,5 g (19,1 mMol) 5-Methylsulfanyl-1H-[1,2,4]triazol-3-ylamin werden in 5 ml Tri-n-Butylamin 6 Stunden auf 180°C erhitzt, wobei entstehendes Methanol abdestilliert wird. Das Tri-n-Butylamin wird unter stark verminderterem Druck abdestilliert. Man erhält 7,9 g (99,7 % der Theorie) rohes 79 %iges 2-Methylsulfanyl-6-(2,4,6-trifluor-phenyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-5,7-diol, das ohne Reinigung weiter umgesetzt wird.

10 HPLC: logP = 0,47

Verwendungsbeispiele:Beispiel A

5 Podosphaera-Test (Apfel) / protektiv

Lösungsmittel : 24,5 Gewichtsteile Aceton

24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid

Emulgator : 1,0 Gewichtsteile Alkyl-Aryl-Polyglykolether

10

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wässrigen Sporensuspension des Apfelmehltauerregers Podosphaera leucotricha inkuliert. Die Pflanzen werden dann im Gewächshaus bei ca. 23°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 70 % aufgestellt.

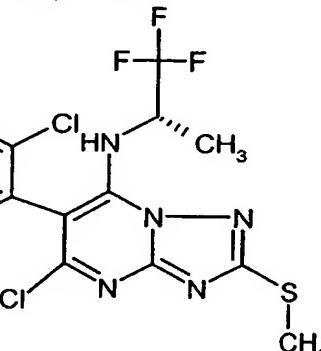
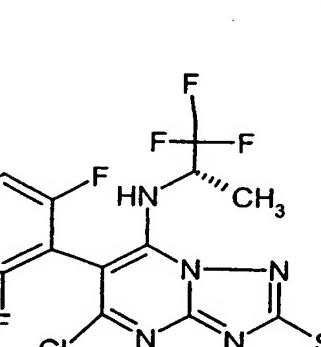
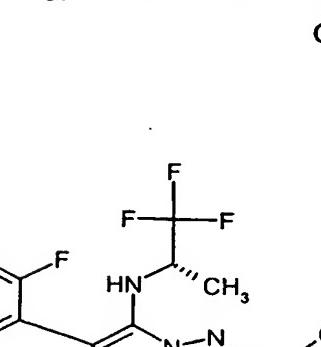
20 10 Tage nach der Inkulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

25

Wirkstoffe, Aufwandmengen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor:

Tabelle A

Podosphaera-Test (Apfel) / protektiv

Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkungsgrad in %
Erfindungsgemäß:	Wirkstoff in g/ha
	100
(8)	100
	100
(9)	94
	100
(2b)	98

Beispiel B

Venturia - Test (Apfel) / protektiv

- 5 Lösungsmittel : 24,5 Gewichtsteile Aceton
 24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid
Emulgator : 1,0 Gewichtsteile Alkyl-Aryl-Polyglykolether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wässrigen Konidiensuspension des Apfelschorferregers Venturia inaequalis inokuliert und verbleiben dann 1 Tag bei ca. 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit in einer Inkubations-kabine.

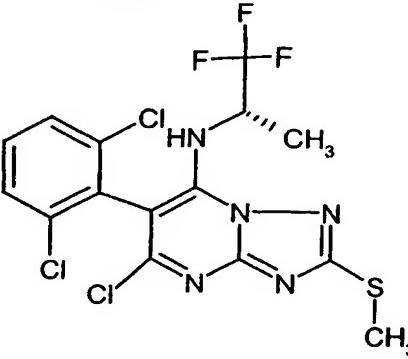
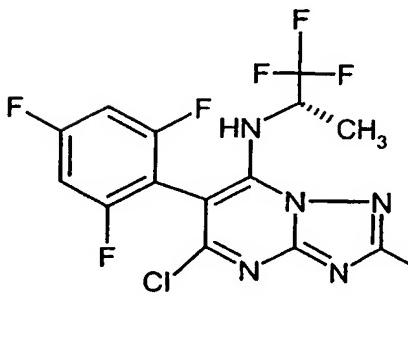
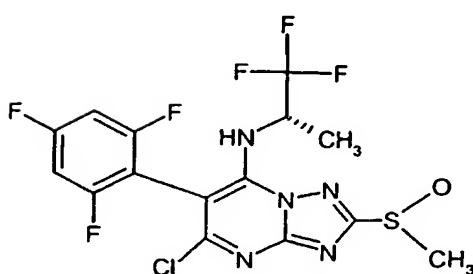
20 Die Pflanzen werden dann im Gewächshaus bei ca. 21°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 90 % aufgestellt.

25 12 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100% bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

Wirkstoffe, Aufwandmengen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

Tabelle B

Venturia-Test (Apfel) / protektiv

Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkungsgrad in %	Wirkstoff in g/ha
Erfundungsgemäß:		
	100	100
(8)		
	100	100
(9)		
	100	100
(2b)		

Beispiel C

In vitro-Test zur Bestimmung der ED₅₀ an Mikroorganismen

- 5 Lösungsmittel: 1 ml Methanol
Emulgator: 6 mg ethoxyliertes Tristyrylphenol

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 20 µg Wirkstoff mit den oben angegebenen Mengen an Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit dem angegebenen Lösungsmittel/Emulgator-Gemisch auf die jeweils gewünschte Konzentration.

Jeweils 10 µl der Zubereitung werden in die Kavitäten von Mikrotiterplatten einpipettiert. Nachdem das Lösungsmittel verdampft ist, werden je Kavität jeweils 200 µl eines Potato-Dextrose Mediums hinzugefügt, das zuvor mit der jeweils gewünschten Konzentration an Sporen bzw. Myzel des zu prüfenden Mikroorganismus versetzt worden war. Die resultierenden Konzentrationen an Wirkstoff in den Kavitäten betragen

- 20 0,1 ppm
 1 ppm
 10 ppm
 bzw. 100 ppm.

- 25 Die resultierende Konzentration an Emulgator beträgt jeweils 300 ppm.

Zur Inkubation werden die Mikrotiterplatten anschließend 3 bis 5 Tage auf einem Schüttler bei einer Temperatur von 22°C bewegt, bis in der unbehandelten Kontrolle ein ausreichendes Wachstum des jeweiligen Mikroorganismus feststellbar ist.

- 98 -

Die Auswertung erfolgt photometrisch bei einer Wellenlänge von 620 nm. Aus den Messdaten für die verschiedenen Konzentrationen wird die Wirkstoffdosis berechnet, die zu einer 50 %igen Hemmung des Pilzwachstums (ED_{50}) gegenüber der unbehandelten Kontrolle führt.

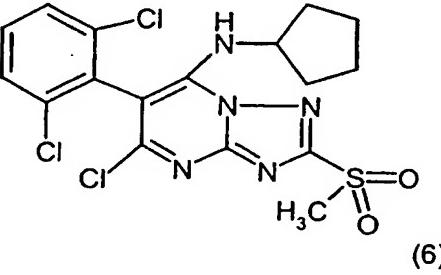
5

Wirkstoffe und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

Tabelle C

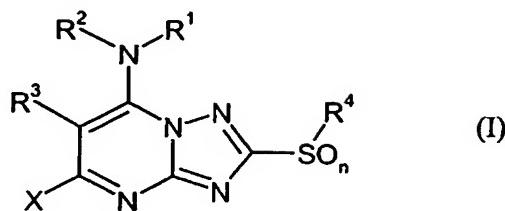
In vitro-Test zur ED₅₀-Bestimmung bei Mikroorganismen

5

Wirkstoff	Mikroorganismus	ED ₅₀ -Wert
Erfindungsgemäß:		
 (6)	Pyricularia oryzae	0,24
 (II-2)	Pyricularia oryzae	0,33

Patentansprüche

1. Triazolopyrimidine der Formel



in welcher

10 R¹ für Amino für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Alkinyl, gegebenenfalls substituiertes Cyloalkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkoxy, gegebenenfalls substituiertes Alkenyloxy, gegebenenfalls substituiertes Alkinyloxy, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyloxy, gegebenenfalls substituiertes Alkylamino, gegebenenfalls substituiertes Dialkylamino, gegebenenfalls substituiertes Alkenylamino, gegebenenfalls substituiertes Alkinylamino, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkylamino, gegebenenfalls substituiertes N-Cycloalkyl-N-alkyl-amino, gegebenenfalls substituiertes Alkylidien-amino, gegebenenfalls substituiertes Heterocycl oder für einen Rest der Formel -S-R⁵ steht, worin

15

15

20

R⁵ für gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Alkinyl oder gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl steht,

25

R² für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Alkinyl oder gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl steht,

oder

R¹ und R² gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen gegebenenfalls substituierten heterocyclischen Ring stehen,

5

R³ für gegebenenfalls substituiertes Aryl steht,

R⁴ für gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkenyl oder gegebenenfalls substituiertes Alkinyl steht,

10

X für Halogen steht und

n für 0, 1 oder 2 steht,

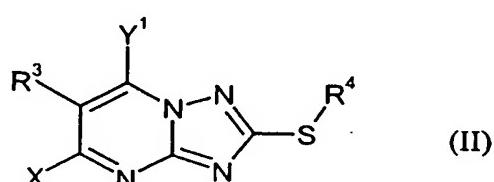
15

sowie Säureadditions-Salze, von denjenigen Verbindungen der Formel (I), in denen

R¹ für Amino steht.

20 2. Verfahren zur Herstellung von Triazolopyrimidinen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man

a) Dihalogen-triazolopyrimidine der Formel



25

in welcher

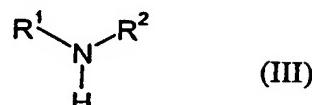
R³, R⁴ und X die oben angegebenen Bedeutungen haben und

- 102 -

Y¹ für Halogen steht,

mit Aminen der Formel

5



in welcher

R¹ und R² die oben angegebenen Bedeutungen haben,

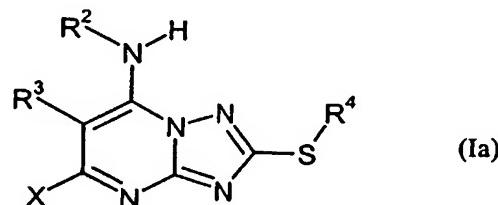
10

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzessors umsetzt,

oder

15

b) Triazolopyrimidine der Formel



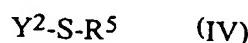
in welcher

20

R², R³, R⁴ und X die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Sulfensäurehalogeniden der Formel

25



in welcher

5 R⁵ die oben angegebenen Bedeutungen hat und

Y² für Halogen steht,

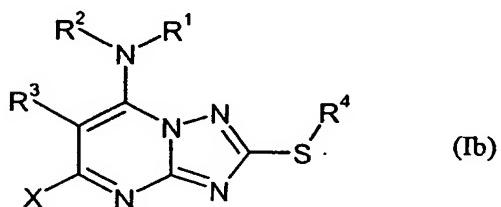
5

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors umsetzt,

oder

10

c) Triazolopyrimidine der Formel



in welcher

15

R¹, R², R³, R⁴ und X die oben angegebenen Bedeutungen haben,

20

mit Sauerstoff abgebenden Oxidationsmitteln gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators umsetzt,

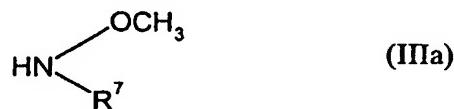
und gegebenenfalls an die so erhaltenen Verbindungen der Formel (I), in denen

25

R¹ für Amino steht,

eine Säure addiert.

3. Mittel zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einem Triazolopyrimidin der Formel (I) gemäß Anspruch 1 bzw. an einem Säureadditions-Salz davon neben Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen.
- 5
4. Verwendung von Triazolopyrimidinen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 bzw. von deren Säureadditions-Salzen zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen.
- 10 5. Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Triazolopyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 1 bzw. deren Säureadditions-Salze auf die unerwünschten Mikroorganismen und/oder deren Lebensraum aus bringt.
- 15 6. Verfahren zur Herstellung von Mitteln zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Triazolopyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 1 bzw. deren Säureadditions-Salze mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen vermischt.
- 20 7. Amine der Formel



in welcher

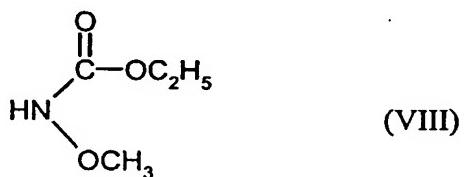
25

R^7 für Isobutyl, 2-Methoxyethyl oder für $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$ steht.

8. Verfahren zur Herstellung von Aminen der Formel (IIIa) gemäß Anspruch 7, dadurch gekennzeichnet, dass man

f) in einer ersten Stufe N-Methoxy-carbaminsäure-ethylester der Formel

5



mit Halogenverbindungen der Formel

10

$\text{R}^7\text{-X}^1$ (IX)

in welcher

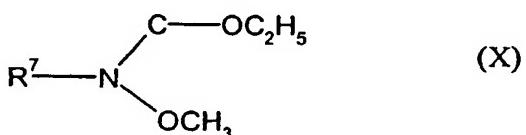
R^7 die oben angegebenen Bedeutungen hat und

15

X^1 für Brom oder Iod steht;

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt und die entstehenden Carbamate der Formel

20



in welcher

25

R^7 die oben angegebenen Bedeutungen hat,

- 106 -

in einer zweiten Stufe mit Kaliumhydroxid in Gegenwart von Ethanol und Wasser umsetzt.

9. Amine der Formel

5

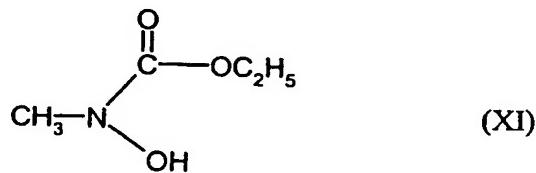


in welcher

10 R^7 für Isobutyl, 2-Methoxyethyl oder für $\begin{array}{c} \text{---CH}_2-\text{C}=\text{CH}_2 \\ | \\ \text{CH}_3 \end{array}$ steht.

10. Verfahren zur Herstellung von Aminen der Formel (IIIb) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man

15 g) in einer ersten Stufe N-Hydroxy-N-methyl-carbaminsäureethylester der Formel



20 mit Halogenverbindungen der Formel



in welcher

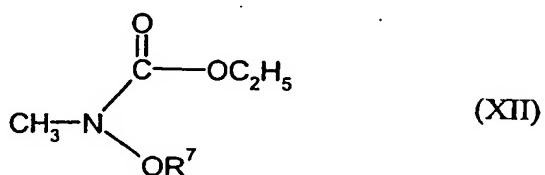
25

- 107 -

R⁷ und X¹ die oben angegebene Bedeutung haben,

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt und die entstehenden Carbamate der Formel

5



in welcher

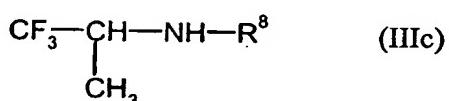
10

R⁷ die oben angegebenen Bedeutungen hat,

in einer zweiten Stufe mit Kaliumhydroxid in Gegenwart von Ethanol und Wasser umsetzt.

15

11. Trifluorisopropylamine der Formel



in welcher

20

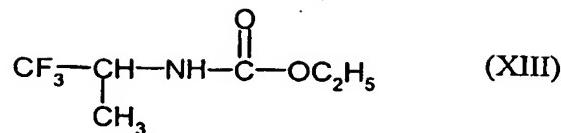
R⁸ für Methyl, Ethyl oder Propyl steht.

12. Verfahren zur Herstellung von Trifluorisopropylaminen der Formel (IIIc) gemäß Anspruch 11, dadurch gekennzeichnet, dass man

25

h) in einer ersten Stufe N-Trifluor-isopropyl-carbaminsäure-ethylester der Formel

- 108 -



mit Halogenverbindungen der Formel

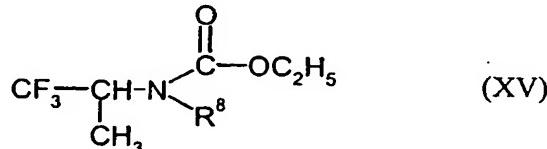
5



in welcher

10 R^8 und X^1 die oben angegebenen Bedeutungen haben,in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt
und die entstehenden Carbamate der Formel

15



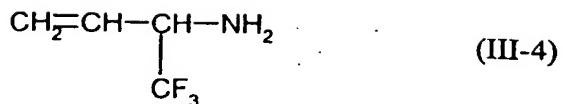
in welcher

20 R^8 die oben angegebenen Bedeutungen haben,in einer zweiten Stufe mit Kaliumhydroxid in Gegenwart von Ethanol und
Wasser umsetzt.

13. 3-Trifluormethyl-3-amino-propen der Formel

25

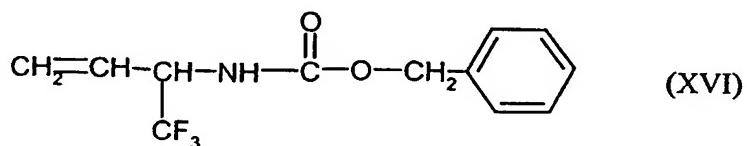
- 109 -



14. Verfahren zur Herstellung von 3-Trifluormethyl-3-amino-propen der Formel (III-4) gemäß Anspruch 13, dadurch gekennzeichnet, dass man

5

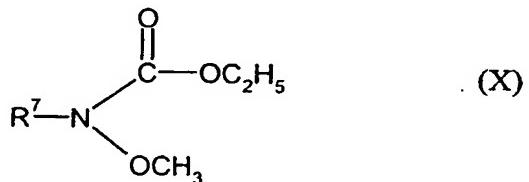
- i) das Carbamat der Formel



mit wässriger Salzsäure umsetzt.

10

15. Carbamate der Formel



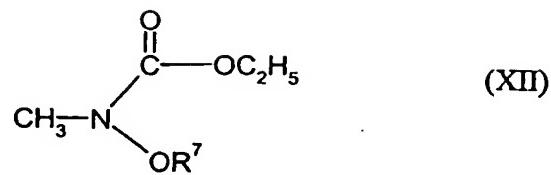
15

in welcher

R^7 für Isobutyl, 2-Methoxyethyl oder für $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$ steht.

- 110 -

16. Carbamate der Formel



5

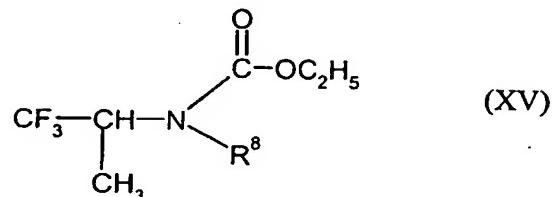
in welcher

R^7 für Isobutyl, 2-Methoxyethyl oder für $\text{---CH}_2-\underset{\text{CH}_3}{\text{C}}=\text{CH}_2$ steht.



17. Carbamate der Formel

10



in welcher

R^8 für Methyl, Ethyl oder Propyl steht.

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
7. November 2002 (07.11.2002)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 02/088127 A3

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: C07D 487/04, A01N 43/90 // (C07D 487/04, 249:00, 239:00)

(74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER AKTIENGESELLSCHAFT; 51368 Leverkusen (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP02/04441

(81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(22) Internationales Anmeldedatum:

23. April 2002 (23.04.2002)

(25) Einreichungssprache:

Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache:

Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
101 21 102.3 27. April 2001 (27.04.2001) DE

(84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): GEBAUER, Olaf [DE/DE]; Jesuitengasse 111, 50737 Köln (DE). GREUL, Jörg, Nico [DE/DE]; Am Sandberg 30 a, 42799 Leichlingen (DE). HEINEMANN, Ulrich [DE/DE]; Am Sonnenhang 1, 42799 Leichlingen (DE). ELBE, Hans-Ludwig [DE/DE]; Dasnöckel 59, 42329 Wuppertal (DE). KRÜGER, Bernd-Wieland [DE/DE]; Am Vorend 52, 51467 Bergisch Gladbach (DE). DUNKEL, Ralf [DE/DE]; Krischerstr. 22, 40789 Monheim (DE). VOERSTE, Arnd [DE/DE]; Salierring 33, 50677 Köln (DE). EBBERT, Ronald [DE/DE]; Hildorfer Str. 305, 51371 Leverkusen (DE). WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike [DE/DE]; Oberer Markenweg 85, 56566 Neuwied (DE). KUCK, Karl-Heinz [DE/DE]; Pastor-Löh-Str. 30a, 40764 Langenfeld (DE). KITAGAWA, Yoshinori [JP/JP]; 1085, Aramachi, Moka-shi, Tochigi 321-4305 (JP).

Erklärung gemäß Regel 4.17:

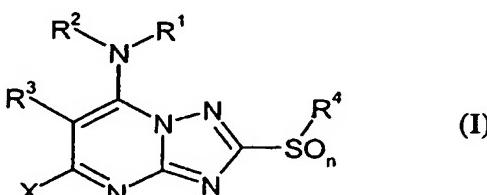
hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii) für die folgenden Bestimmungsstaaten AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW, ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: TRIAZOLOPYRIMIDINES

(54) Bezeichnung: TRIAZOLOPYRIMIDINE

WO 02/088127 A3



(57) Abstract: The invention relates to novel triazolo[4,3-d]pyrimidines of formula (I), wherein R¹, R², R³, R⁴, X and n have the meaning cited in the description. The invention also relates to several methods for the production of said novel substances and to their use in controlling undesirable microorganisms. The invention further relates to intermediate products having the formula cited in the description and to methods for the production of said intermediate products.

(57) Zusammenfassung: Neue Triazolo[4,3-d]pyrimidine der Formel (I), in welcher R¹, R², R³, R⁴, X und n die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen haben, mehrere Verfahren zur Herstellung dieser neuen Stoffe und deren Verwendung zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen. Neue Zwischenprodukte der in der Beschreibung angegebenen Formeln sowie Verfahren zur Herstellung dieser Zwischenprodukte.



Veröffentlicht:

- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

(88) Veröffentlichungsdatum des internationalen Recherchenberichts:

27. Dezember 2002

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/02/04441

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 C07D487/04 A01N43/90 // (C07D487/04, 249:00, 239:00)

(S1) Internationale Patentklassifikation: C07D 487/04,
A01N 43/90 // (C07D 487/04, 249:00, 239:00)

According to International Patent Classification (IPC) or to both National classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	EP 0 834 513 A (AMERICAN CYANAMID CO) 8 April 1998 (1998-04-08) cited in the application claim 1 ---	1
Y	US 5 965 561 A (LIERS PETER ET AL) 12 October 1999 (1999-10-12) claim 1 ---	1
A	US 4 981 507 A (JELICH KLAUS ET AL) 1 January 1991 (1991-01-01) claim 1 -----	1

 Further documents are listed in the continuation of box C. Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents :

- "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- "E" earlier document but published on or after the international filing date
- "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

9 August 2002

Date of mailing of the international search report

13.08.02

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Bakboord, J

INTERNATIONAL SEARCH REPORTInternational application No.
PCT/EP 02/04441**Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)**

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. Claims Nos.: because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:

2. Claims Nos.: because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:

3. Claims Nos.: because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

1. As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:

4. No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

1-6

Remark on Protest

- The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.
 No protest accompanied the payment of additional search fees.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
EP02/04441

The International Searching Authority has determined that this international application contains more than one invention or group of inventions, namely

1. Claims 1-6

triazolopyrimidines to control undesirable microorganisms.

2. Claims 7-17

amines of Formula III and the preparation thereof.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

/EP 02/04441

Patent document cited in search report	Publication date		Patent family member(s)	Publication date
EP 0834513	A 08-04-1998	US	5817663 A	06-10-1998
		AT	221069 T	15-08-2002
		DE	69714171 D1	29-08-2002
		EP	0834513 A2	08-04-1998
		JP	10152489 A	09-06-1998
		US	5965561 A	12-10-1999
<hr/>				
US 5965561	A 12-10-1999	US	5817663 A	06-10-1998
		AT	221069 T	15-08-2002
		DE	69714171 D1	29-08-2002
		EP	0834513 A2	08-04-1998
		JP	10152489 A	09-06-1998
<hr/>				
US 4981507	A 01-01-1991	DE	3812350 A1	26-10-1989
		AU	3300089 A	19-10-1989
		BR	8901754 A	28-11-1989
		DK	178589 A	15-10-1989
		EP	0337232 A1	18-10-1989
		JP	1305088 A	08-12-1989
		ZA	8902704 A	27-12-1989
<hr/>				

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHTT

Internationales Aktenzeichen

PCT 02/04441

A. KLASIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES
IPK 7 C07D487/04 A01N43/90 // (C07D487/04, 249:00, 239:00)

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)
IPK 7 C07D A01N

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, CHEM ABS Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie ^a	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	EP 0 834 513 A (AMERICAN CYANAMID CO) 8. April 1998 (1998-04-08) in der Anmeldung erwähnt Anspruch 1 ---	1
Y	US 5 965 561 A (LIERS PETER ET AL) 12. Oktober 1999 (1999-10-12) Anspruch 1 ---	1
A	US 4 981 507 A (JELICH KLAUS ET AL) 1. Januar 1991 (1991-01-01) Anspruch 1 -----	1

Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

Siehe Anhang Patentfamilie

^a Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

"E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmelddatum veröffentlicht worden ist

"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmelddatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmelddatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erforderlicher Tätigkeit beruhend betrachtet werden

"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erforderlicher Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

"&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

Absendedatum des Internationalen Recherchenberichts

9. August 2002

12.8.2002

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde

Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Bakboord, J

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

internationales Aktenzeichen
PCT/EP 02/04441

Feld I Bemerkungen zu den Ansprüchen, die sich als nicht recherchierbar erwiesen haben (Fortsetzung von Punkt 2 auf Blatt 1)

Gemäß Artikel 17(2)a) wurde aus folgenden Gründen für bestimmte Ansprüche kein Recherchenbericht erstellt:

1. Ansprüche Nr.
weil sie sich auf Gegenstände beziehen, zu deren Recherche die Behörde nicht verpflichtet ist, nämlich

2. Ansprüche Nr.
weil sie sich auf Teile der internationalen Anmeldung beziehen, die den vorgeschriebenen Anforderungen so wenig entsprechen, daß eine sinnvolle internationale Recherche nicht durchgeführt werden kann, nämlich

3. Ansprüche Nr.
weil es sich dabei um abhängige Ansprüche handelt, die nicht entsprechend Satz 2 und 3 der Regel 6.4 a) abgefaßt sind.

Feld II Bemerkungen bei mangelnder Einheitlichkeit der Erfindung (Fortsetzung von Punkt 3 auf Blatt 1)

Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, daß diese internationale Anmeldung mehrere Erfindungen enthält:

siehe Zusatzblatt

1. Da der Anmelder alle erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht auf alle recherchierbaren Ansprüche.

2. Da für alle recherchierbaren Ansprüche die Recherche ohne einen Arbeitsaufwand durchgeführt werden konnte, der eine zusätzliche Recherchengebühr gerechtfertigt hätte, hat die Behörde nicht zur Zahlung einer solchen Gebühr aufgefordert.

3. Da der Anmelder nur einige der erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht nur auf die Ansprüche, für die Gebühren entrichtet worden sind, nämlich auf die Ansprüche Nr.

4. Der Anmelder hat die erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren nicht rechtzeitig entrichtet. Der internationale Recherchenbericht beschränkt sich daher auf die in den Ansprüchen zuerst erwähnte Erfindung; diese ist in folgenden Ansprüchen erfaßt:
1-6

Bemerkungen hinsichtlich eines Widerspruchs

- Die zusätzlichen Gebühren wurden vom Anmelder unter Widerspruch gezahlt.
 Die Zahlung zusätzlicher Recherchengebühren erfolgte ohne Widerspruch.

WEITERE ANGABEN

PCT/ISA/ 210

Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, daß diese internationale Anmeldung mehrere (Gruppen von) Erfindungen enthält, nämlich:

1. Ansprüche: 1-6

Triazolopyrimidine zur Bekämpfung unerwünschten Mikroorganismen

2. Ansprüche: 7-17

Amine der Formel III und deren Herstellung

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationale Aktenzeichen

PCT/EP 02/04441

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung		Mitglied(er) der Patentfamilie		Datum der Veröffentlichung
EP 0834513	A	08-04-1998	US	5817663 A		06-10-1998
			AT	221069 T		15-08-2002
			DE	69714171 D1		29-08-2002
			EP	0834513 A2		08-04-1998
			JP	10152489 A		09-06-1998
			US	5965561 A		12-10-1999
<hr/>						
US 5965561	A	12-10-1999	US	5817663 A		06-10-1998
			AT	221069 T		15-08-2002
			DE	69714171 D1		29-08-2002
			EP	0834513 A2		08-04-1998
			JP	10152489 A		09-06-1998
<hr/>						
US 4981507	A	01-01-1991	DE	3812350 A1		26-10-1989
			AU	3300089 A		19-10-1989
			BR	8901754 A		28-11-1989
			DK	178589 A		15-10-1989
			EP	0337232 A1		18-10-1989
			JP	1305088 A		08-12-1989
			ZA	8902704 A		27-12-1989
<hr/>						